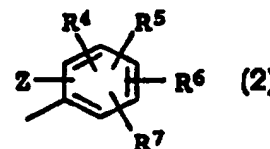
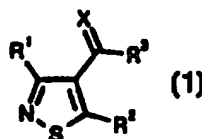




PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 417/10, A01N 43/80</p>	<p>A1</p>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/38996</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 23. Oktober 1997 (23.10.97)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/01855</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 14. April 1997 (14.04.97)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: 196 14 858.8 16. April 1996 (16.04.96) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ENGEL, Stefan [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 13, D-65510 Idstein (DE). VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). KARDORFF, Uwe [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). PLATH, Peter [DE/DE]; Hans-Balcke-Strasse 13, D-67227 Frankenthal (DE). VOSSEN, Marcus [DE/DE]; Wilhelm-Wundt-Strasse 7, D-68199 Mannheim (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Am Herzel 40, D-67433 Neustadt (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN,</p>		<p>Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, IL, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, UZ, VN, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht.</p>
<p>(54) Title: HERBICIDAL HETEROCYCLICALLY SUBSTITUTED BENZOYLISOTHIAZOLES</p> <p>(54) Bezeichnung: HERBIZIDE HETEROCYCLISCH SUBSTITUIERTE BENZOYLISOTHIAZOLE</p> <p>(57) Abstract</p> <p>4-benzoylisothiazoles have the general formula (1), in which the substituents have the following meanings: X stands for oxygen or sulphur; R¹ stands for hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, optionally substituted alkoxy-carbonyl, aryl, heterocyclyl or hetaryl; R² stands for hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or cycloalkenyl, whereas these radicals can bear one or several halogen, alkyl, alkenyl or alkynyl groups, or R² stands for aryl, hetaryl or heterocyclyl; R³ stands for a radical of general formula (2), in which Z and the R⁴, R⁵, R⁶ and R⁷ substituents have the meanings given in claim 1. Also disclosed are the salts commonly used in agriculture of the 4-benzoylisothiazoles of general formula (1), a process for preparing the same and their use as herbicides.</p> <p>(57) Zusammenfassung</p> <p>4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel (1), in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben: X Sauerstoff oder Schwefel; R¹ Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; ggf. subst. Alkoxy-carbonyl; ggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf. subst. Hetaryl; R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, wobei diese Reste eine oder mehrere der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl; Aryl, Hetaryl oder Heterocyclyl; R³ ein Rest der allgemeinen Formel (2), in der Z und die Substituenten R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sowie landwirtschaftlich übliche Salze der 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel (1), Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.</p>		



BEST AVAILABLE COPY

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland			TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	NZ	Neuseeland		
CM	Kamerun			PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Libertä	SG	Singapur		

Herbizide heterocyclisch substituierte Benzoylisothiazole

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylisothiazole, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

- 10 Aus der Patentliteratur (EP 0 527 036, EP 0 527 037, EP 0 560 482, EP 0 580 439, EP 0 588 357, EP 609 797, EP 0 609 798, EP 0 636 622, WO 94/14782, WO 94/ 18179, WO 95/15691 und WO 95/16678) ist bekannt, daß substituierte 4-Benzoyl-5-cycloalkylisoxazole eine Verbindungsklasse mit ausgeprägter herbizider
- 15 Aktivität im Voraufverfahren darstellen. 4-(2-Sulfonylmethyl-4-trifluormethylbenzoyl)-5-cyclopropylisoxazol, ein Vertreter dieser Verbindungsklasse wird von Rhône-Poulenc als herbizider Wirkstoff gegen mono- und dikotyle Schädipflanzen im Voraufverfahren in Mais entwickelt (RPA 201772, Technical
- 20 Bulletin).

Darüber hinaus ist die herbizide und insektizide Aktivität substituerter 4-Alkyl- bzw. 4-Cycloalkyl-5-aryl- bzw.-5-hetarylisoxazole bekannt (GB 2 284 600, WO 95/ 22903, WO 95/22904 und WO

25 95/25105).

Die herbizide Aktivität der bekannten Verbindungen ist bei mangelhafter Wirkung im Nachaufverfahren auch im Voraufverfahren bei unvollständiger Kulturpflanzenverträglichkeit nur

30 teilweise befriedigend.

Erfindungsgemäße herbizide oder insektizide 4-Benzoylisothiazole sind dem Stand der Technik bisher nicht zu entnehmen.

- 35 4-Benzoylisothiazole haben bisher nur geringes synthetisches Interesse erfahren. Substituierte Isothiazole und ihre carbocyclisch anellierten Derivate sind zwar Ziel grundlegender Untersuchungen gewesen (beispielsweise: D. L. Pain, B. J. Peart, K. R. H. Wooldridge, Comprehensive Heterocyclic Chemistry,
- 40 Vol. 6, Teil 4B, S. 131, Hrsq. A.R. Katritzky, Pergamon Press, Oxford, 1984), acylierte und insbesondere benzoylierte Derivate wurden in der Literatur nur vereinzelt beschrieben (beispielsweise: A. J. Layton, E. Lunt, J. Chem. Soc. (1968) 611, A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, C. M. Sanudo, Synth. Commun. 17
- 45 (1987) 1207, A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, C. M. Sanudo, J. Heterocycl. Chem. 25 (1988) 235).

2

Einige durch Hydroxypropylaminocarbonyl substituierte 4-Benzoyl-isothiazole sind in EP 0 524 781 und EP 0 617 010 als Muskel-relaxantien bzw. als geeignete therapeutische Amide bei Inkontinenz untersucht worden. 3,5-Di-(tertiärbutyl)-4-hydroxybenzoyl-
5 isothiazole wirken laut EP 0 449 223 als Inhibitoren der 5-Lipoxygenase und Cyclooxygenase entzündungshemmend.

Aus US 5 034 385 geht hervor, daß durch Carbapeneme substituierte Benzoylisothiazole antibakterielle Wirkung aufweisen.

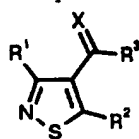
10

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue herbizide Wirkstoffe mit verbessertem Wirkprofil und Kulturpflanzenverträglichkeit zur Verfügung zu stellen.

15 Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 bei Kulturpflanzenverträglichkeit ausgeprägte herbizide Aktivität gegen Schadpflanzen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind 4-Benzoylisothiazole
20 der allgemeinen Formel 1

25



1

30 in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

35 R¹ Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; ggf. subst. Alkoxy-carbonyl;
 ggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf. subst. Hetaryl;

40 R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, wobei diese Reste einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;

45 Aryl, wobei dieser Rest einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen kann:
 Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Alkylthio oder Alkenylthio, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder einen oder

3

mehrere der folgenden Gruppen tragen können:

Alkoxy, Alkenyloxy, Aryloxy, Alkylsulfonyl, Alkenylsulfonyl oder Arylsulfonyl;

Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl;

5 ggf. subst. Aryloxy oder ggf. subst. Arylthio;

ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst.

Mono- oder Diarylamino oder ggf. subst. N-Alkyl-N-aryl-amino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können;

10 Halogen, Cyano oder Nitro;

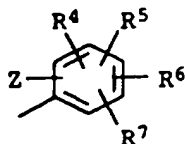
Hetaryl oder Heterocyclyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen können:

15 Alkyl, Alkoxy oder Aryl und wobei im Fall von Heterocyclyl mindestens einer der Stickstoffe eine der folgenden Gruppen tragen kann:

20 Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Haloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Cycloalkyloxy, Haloalkoxy, ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Aryloxy;

R³ ein Rest der allgemeinen Formel 2

25



2

30

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

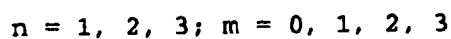
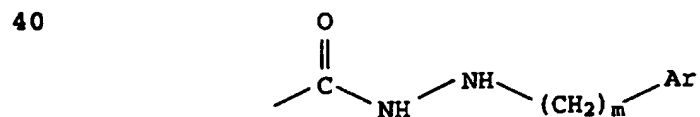
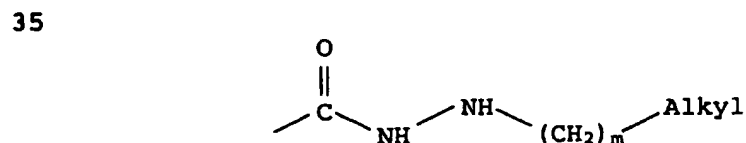
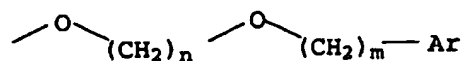
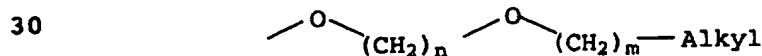
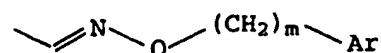
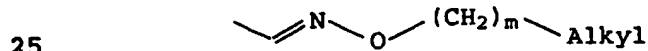
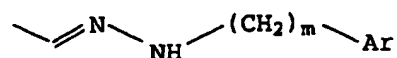
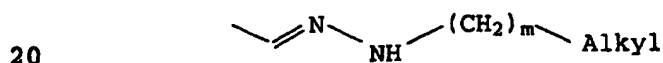
2 Z 5- oder 6-gliedrige heterocyclische, gesättigte oder
 35 ungesättigte Reste, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, Alkyl, Haloalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Haloalkylthio, Di-alkylamino oder ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder
 40 der mit einem ankondensierten durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl oder Haloalkyl substituierten Phenylring,
 45 einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Di-alkyl-

kylamino, Alkoxy, Haloalkoxy, oder Haloalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet,

- R^4-R^7 können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkenyl, Cycloalkylalkinyl, Aryl, Arylalkyl, Arylalkenyl, Arylalkinyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkoxy, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkenyloxy, Cycloalkylalkinyloxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Arylalkoxy, Arylalkenyloxy, Arylalkinyloxy, Thio, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkylalkylthio, Cycloalkylalkenylthio, Cycloalkylalkinylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Arylalkylthio, Arylalkenylthio, Arylalkinylthio, Amino, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, Cycloalkenylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkenylsulfonyl, Alkinylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Cycloalkylalkylsulfonyl, Cycloalkylalkenylsulfonyl, Cycloalkylalkinylsulfonyl, Arylsulfonyl, Arylalkylsulfonyl, Arylalkenylsulfonyl, Arylalkinylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Alkenylsulfoxyl, Alkinylsulfoxyl, Cycloalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkenylsulfoxyl, Cycloalkylalkinylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Arylalkylsulfoxyl, Arylalkenylsulfoxyl, Arylalkinylsulfoxyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminosulfonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylaminosulfonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminosulfonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Cycloalkylalkenylcarbonyl, Cycloalkylalkinylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl, Arylalkenylcarbonyl, Arylalkinylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Cycloalkoxycarbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Cycloalkylalkenyloxycarbonyl, Cycloalkylalkinyloxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Arylalkenyloxycarbonyl, Arylalkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino-carbonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylamino-carbonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, ggf. subst. Mono- oder Dialkylcarbonylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylcarbonylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylcarbonylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkoxyaminocarbonyl, Alkenyloxycarbonyl-

5

amino, Alkinyloxycarbonylamino, Cycloalkoxycarbonylamino, Cycloalkylalkoxycarbonylamino, Cycloalkylalkenyloxycarbonylamino, Cycloalkylalkinyloxycarbonylamino, Aryloxycarbonylamino, Arylalkoxycarbonylamino, Arylalkenyloxycarbonylamino, Arylalkinyloxycarbonylamino, Halogen, Haloalkyl, Haloalkenyl, Haloalkinyl, Haloalkoxy, Haloalkenyl-oxy, Haloalkinyloxy, Haloalkylthio, Haloalkenylthio, Haloalkinylthio, Haloalkylamino, Haloalkenylamino, Haloalkinylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkenylsulfonyl, Haloalkinylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkenylsulfoxyl, Haloalkinylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkenylcarbonyl, Haloalkinylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl, Haloalkenyloxycarbonyl, Haloalkinyloxycarbonyl, Haloalkylaminocarbonyl, Haloalkenylaminocarbonyl, Haloalkinylaminocarbonyl, Haloalkoxycarbonylamino, Haloalkenyloxycarbonylamino, Haloalkinyloxycarbonylamino, Cyano oder Nitro oder ein der folgenden Gruppen:



6

R⁴, R⁵ können gemeinsam eine fünf- oder sechsgliedrige, gesättigte oder ungesättigte, aromatische oder nicht aromatische, ggf. subst. Alkylen-, Alkenylen- oder Alkdiénylenkette bilden;

5

R⁸ Alkyl, Haloalkyl, Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰,

R⁹ Wasserstoff oder Alkyl,

R¹⁰ Alkyl,

10 sowie landwirtschaftlich übliche Salze der 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1.

Bei der eingangs angegebenen Definitionen der Verbindungen I wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für

15 die folgenden Gruppen stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 oder
20 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methyl-
25 pentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methyl-propyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

30

Alkylamino: eine Aminogruppe, welche eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt trägt;

35 **Dialkylamino:** eine Aminogruppe, welche zwei voneinander unabhängige, geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, trägt;

Alkylcarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1
40 bis 10 Kohlenstoffatomen, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkylsulfonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1
bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen, welche über eine Sulfonylgruppe
45 (-SO₂-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkylsulfoxyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, welche über eine Sulfoxylgruppe (-S(=O)-) an das Gerüst gebunden sind;

- 5 **Alkylaminocarbonyl:** Alkylaminogruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

- Dialkylaminocarbonyl:** Dialkylaminogruppen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen pro Alkylrest wie vorstehend genannt, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

- Alkylaminothiocarbonyl:** Alkylaminogruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, welche über eine Thiocarbonylgruppe (-CS-) an das Gerüst gebunden sind;

- Dialkylaminothiocarbonyl:** Dialkylaminogruppen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen pro Alkylrest wie vorstehend genannt, welche über eine Thiocarbonylgruppe (-CS-) an das Gerüst gebunden sind;

20

- Haloalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlor-methyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluor-methyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Penta-
- 30 fluorethyl;

- Alkoxy:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind, z.B. C₁-C₆-Alkoxy wie
- 35 Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methyl-propoxy, 2-Methylpropoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Pentyloxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 2,2-Di-methylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexyloxy, 1,1-Dimethyl-propoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 1-Methylpentyloxy, 2-Methyl-
- 40 pentyloxy, 3-Methylpentyloxy, 4-Methylpentyloxy, 1,1-Dimethyl-butoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethyl-butoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und
- 45 1-Ethyl-2-methylpropoxy;

8

Alkoxy-carbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, welche über eine Oxycarbonylgruppe (-OC(=O)-) an das Gerüst gebunden sind;

5 **Haloalkoxy:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, und wobei diese Gruppen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden sind;

10

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind, z.B.

- C₁-C₆-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methyl-
 15 ethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio, 1,1-Dimethylethylthio, Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Di-methylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methyl-
 20 pentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Tri-methylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und
 25 1-Ethyl-2-methylpropylthio;

Cycloalkyl: monocyclische Alkylgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

30

- Alkenyl:** geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl,
 35 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl,
 40 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl,
 45 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl,

- 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl,
 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Di-methyl-3-butenyl,
 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl,
 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl,
 5 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl,
 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl,
 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl,
 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl,
 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl,
 10 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl,
 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl,
 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

- Alkenyloxy:** geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit 2 bis
 15 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen
 Position, welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst
 gebunden sind;

- Alkenylthio bzw. Alkenylamino:** geradkettige oder verzweigte
 20 Alkenylgruppen mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbin-
 dung in einer beliebigen Position, welche (Alkenylthio) über ein
 Schwefelatom bzw. (Alkenylamino) ein Stickstoffatom an das Gerüst
 gebunden sind.

- 25 **Alkenylcarbonyl:** geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit
 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer
 beliebigen Position, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an
 das Gerüst gebunden sind;

- 30 **Alkinyl:** geradkettige oder verzweigte Alkinylgruppen mit 2 bis
 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer be-
 liebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkinyl wie Ethinyl, 2-Propinyl,
 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 2-Pentinyl,
 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl,
 35 2-Methyl-3-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl,
 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl,
 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl,
 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,
 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-
 40 3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-
 3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- Alkinyloxy bzw. Alkinylthio und Alkinylamino:** geradkettige oder
 verzweigte Alkinylgruppen mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer
 45 Dreifachbindung in einer beliebigen Position, welche (Alkinyloxy)
 über ein Sauerstoffatom bzw. (Alkinylthio) über ein Schwefelatom

oder (Alkinylamino) über ein Stickstoffatom an das Gerüst gebunden sind.

Alkinylcarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkinylgruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Cycloalkenyl bzw. Cycloalkenyloxy, Cycloalkenylthio und Cycloalkenylamino: monocyclische Alkenylgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, welche direkt bzw. (Cycloalkenyloxy) über ein Sauerstoffatom oder (Cycloalkenylthio) ein Schwefelatom oder (Cycloalkenylamino) über ein Stickstoffatom an das Gerüst gebunden sind, z.B. Cyclopropenyl, Cyclobutenyl, Cyclopentenyl oder Cyclohexenyl.

Cycloalkoxy bzw. Cycloalkylthio und Cycloalkylamino: monocyclische Alkylgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, welche (Cycloalkyloxy) über ein Sauerstoffatom oder (Cycloalkylthio) ein Schwefelatom oder (Cycloalkylamino) über ein Stickstoffatom an das Gerüst gebunden sind, z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

Cycloalkylcarbonyl: Cycloalkgruppen, wie vorstehend definiert, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Cycloalkoxycarbonyl: Cycloalkoxygruppen, wie vorstehend definiert, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkenyloxycarbonyl: Alkenyloxygruppen, wie vorstehend definiert, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinyloxycarbonyl: Alkinyloxygruppen, wie vorstehend definiert, welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Heterocyclyl: drei- bis sechsgliedrige, gesättigte oder partiell ungesättigte mono- oder polycyclische Heterocyclen, die ein bis drei Heteroatome ausgewählt aus einer Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel enthalten, und welche direkt über Kohlenstoff an das Gerüst gebunden sind, wie z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, Oxiranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl.

4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl,
 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl,
 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thia-
 zolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxa-
 5 diazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-
 3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl,
 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Tri-
 azolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl,
 2,3-Dihydro-fur-4-yl, 2,3-Dihydro-fur-5-yl, 2,5-Dihydro-fur-2-yl,
 10 2,5-Dihydro-fur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydro-
 thien-3-yl, 2,3-Dihydrothien-4-yl, 2,3-Dihydrothien-5-yl,
 2,5-Dihydrothien-2-yl, 2,5-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Dihydro-
 pyrrol-2-yl, 2,3-Dihydropyrrol-3-yl, 2,3-Dihydropyrrol-4-yl,
 2,3-Dihydropyrrol-5-yl, 2,5-Dihydropyrrol-2-yl, 2,5-Dihydro-
 15 pyrrol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-4-yl,
 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 4,5-Dihydro-
 isoxazol-4-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisothia-
 zol-3-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl,
 2,3-Dihydroisopyrazol-3-yl, 2,3-Dihydroisopyrazol-4-yl, 2,3-Dihy-
 20 droisopyrazol-5-yl, 4,5-Dihydroisopyrazol-3-yl, 4,5-Dihydroiso-
 pyrazol-4-yl, 4,5-Dihydroisopyrazol-5-yl, 2,5-Dihydroisopyra-
 zol-3-yl, 2,5-Dihydroisopyrazol-4-yl, 2,5-Dihydroisopyrazol-5-yl,
 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydro-
 oxazol-5-yl, 4,5-Dihydrooxazol-3-yl, 4,5-Dihydrooxazol-4-yl,
 25 4,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,5-Dihydrooxazol-3-yl, 2,5-Dihydro-
 oxazol-4-yl, 2,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrothiazol-2-yl,
 2,3-Dihydrothiazol-4-yl, 2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 4,5-Dihydro-
 thiazol-2-yl, 4,5-Dihydrothiazol-4-yl, 4,5-Dihydrothiazol-5-yl,
 2,5-Dihydrothiazol-2-yl, 2,5-Dihydrothiazol-4-yl, 2,5-Dihydro-
 30 thiazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidazol-2-yl, 2,3-Dihydroimidazol-4-yl,
 2,3-Dihydroimidazol-5-yl, 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Dihydro-
 imidazol-4-yl, 4,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,5-Dihydroimidazol-
 2-yl, 2,5-Dihydroimidazol-4-yl, 2,5-Dihydroimidazol-5-yl,
 2-Morpholinyl, 3-Morpholinyl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl,
 35 4-Piperidinyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl,
 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydro-
 pyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydrotriazin-2-yl,
 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl, 1,3-Dihydrooxazin-2-yl,
 1,3-Dithian-2-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
 40 3,4,5,6-Tetrahydropyridin-2-yl, 4H-1,3-Thiazin-2-yl,
 4H-3,1-Benzothiazin-2-yl, 1,1-Dioxo-2,3,4,5-tetrahydrothien-2-yl,
 2H-1,4-Benzothiazin-3-yl, 2H-1,4-Benzoxazin-3-yl, 1,3-Dihydro-
 oxazin-2-yl, 1,3-Dithian-2-yl,

45 Aryl bzw. Aryloxy, Arylthio, Arylcarbonyl, Aryloxycarbonyl, Aryl-
sulfonyl und Arylsulfoxyyl: aromatische mono- oder polycyclische
 Kohlenwasserstoffreste welche direkt bzw. (Aryloxy) über ein

12

- Sauerstoffatom (-O-) oder (Arylthio) ein Schwefelatom (-S-), (Arylcarbonyl) über eine Carbonylgruppe (-CO-), Aryloxycarbonyl über eine Oxycarbonylgruppe (-OCO-), (Arylsulfonyl) über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) oder Arylsulfoxyl über eine Sulfoxylgruppe (-SO-) an das Gerüst gebunden sind, z.B. Phenyl, Naphthyl und Phenanthrenyl bzw. Phenylloxy, Naphthylloxy und Phenanthrenylloxy und die entsprechenden Carbonyl- und Sulfonylreste;

- Arylamino:** aromatische mono- oder polycyclische Kohlenwasserstoffreste, welche über ein Stickstoffatom an das Gerüst gebunden sind.

- Hetaryl:** aromatische mono- oder polycyclische Reste welche neben Kohlenstoffringgliedern zusätzlich ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom enthalten können und welche direkt über Kohlenstoff an das Gerüst gebunden sind, z.B.

- 20 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Triazol-3-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, 1,3,4-Triazol-2-yl;

- 45 - carbocyclisch anneliertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen,

- welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
- 5
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl;
- 10
- 15
- 20
- benzokondensiertes 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können, z.B. Chinolin, Isochinolin, Chinazolin und Chinoxalin,

bzw. die entsprechenden Oxy-, Thio-, Carbonyl- oder Sulfonylgruppen.

25

Die Angabe "partiell oder vollständig halogeniert" soll zum Ausdruck bringen, daß in den derart charakterisierten Gruppen die Wasserstoffatome zum Teil oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können.

30

Ggf. subst. bedeutet, daß die entsprechende organische Gruppe beliebig substituiert sein kann, wobei prinzipiell alle in dieser Anmeldung aufgeführten Substituenten in Frage kommen.

35

Bevorzugte Substituenten sind Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkenyl, Aryl, Arylalkyl, Arylalkenyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Cycloalkoxy, Cycloalkylalkoxy, Aryloxy, Arylalkoxy, Thio, Alkylthio, Alkenylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkylalkylthio, Arylthio, Arylalkylthio, Amino, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkenylamino, Cycloalkylamino, Cycloalkenylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkenylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Cycloalkylalkylsulfonyl, Arylsulfonyl, Arylalkylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Alkenylsul-

40

45

foxyl, Cycloalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Arylalkylsulfoxyl, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxy carbonyl, Cycloalkoxy carbonyl, Cycloalkylalkoxy carbonyl, Aryloxy carbonyl, Arylalkoxy carbonyl, Aminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino carbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino carbonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminocarbonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkoxyaminocarbonyl, Alkenyloxy carbonyl, Cycloalkoxy carbonyl, Aryloxy carbonyl, Arylalkoxy carbonyl, Halogen, Haloalkyl, Haloalkenyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, Haloalkoxy, Haloalkenyloxy, Haloalkylthio, Haloalkenylthio, Haloalkylamino, Haloalkenylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkenylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkenylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkenylcarbonyl, Haloalkoxy carbonyl, Haloalkenyloxy carbonyl, Haloalkylaminocarbonyl, Haloalkenylaminocarbonyl, Haloalkoxy carbonyl, Haloalkenyloxy carbonyl, Cyano oder Nitro.

20 Besonders bevorzugte Substituenten sind Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Hydroxy, Alkoxy, Cycloalkoxy, Aryloxy, Thio, Alkylthio, Cycloalkylthio, Arylthio, Amino, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylmino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Cycloalkylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Arylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Alkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxy carbonyl, Aryloxy carbonyl, Amino carbonyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino carbonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminocarbonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkoxyaminocarbonyl, Aryloxy carbonyl, Halogen, Haloalkyl, Haloalkoxy, Haloalkylthio, Haloalkylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkoxy carbonyl, Haloalkoxy carbonyl, Cyano oder Nitro.

Im Hinblick auf ihre biologische Wirkung sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1 bevorzugt, in der X Sauerstoff bedeutet.

40 Weiterhin sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1 bevorzugt, in der R¹ Wasserstoff oder ggf. subst. Alkoxy carbonyl bedeutet.

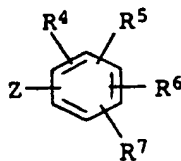
Bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel 1, in der R¹ Wasserstoff oder Alkoxy carbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, 45 die einfach oder mehrfach durch Fluor, Chlor oder Brom substituiert sein können, bedeutet.

15

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel 1, in der R¹ Wasserstoff, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl bedeuten.

- Ferner sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1 bevorzugt, in
- 5 der R² Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Isopropyl oder tertiär Butyl; oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, besonders bevorzugt Cyclopropyl oder 1-Methylcyclopropyl; oder Phenyl, wobei dieser Rest einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen kann:
- 10 Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder Halogen, besonders bevorzugt 3-Trifluormethylphenyl, 2,4-Difluorphenyl; Hetaryl oder Heterocyclyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen
- 15 können: Alkyl, Alkoxy oder Phenyl, besonders bevorzugt 1,3-Benzodioxol, 2,2-Difluor-1,3-benzodioxol, 1,3-Benzoxathiol, 3,3-Dioxo-1,3-Benzoxathiol, Benzoxazol, Pyrazolyl oder Thienyl.

- Bevorzugt sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel 1,
- 20 in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2



25

2

- 30 steht, in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- Z 5- oder 6-gliedrige heterocyclische, gesättigte oder ungesättigte Reste, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder
- 35 Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Haloalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Haloalkylthio, Di-C₁-C₄-Alkylamino, ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder
- 40 C₁-C₄-Haloalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxo-Gruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Haloalkyl sub-
- 45 stituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, Di-C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Alkoxy,

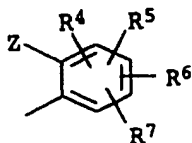
16

C₁-C₄-Haloalkoxy, oder C₁-C₄-Haloalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet;

- 5 R⁴-R⁷ können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Aryl, Hydroxy, Alkoxy, Cycloalkoxy, Aryloxy, Thio, Alkylthio, Cycloalkylthio, Arylthio, Amino, ggf. substituiertes Mono- oder Dialkylamino bzw. Mono- oder Diarylamino bzw. N-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder
- 10 verschieden sein können, Cycloalkylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Arylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Cycloalkylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Alkylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkoxycarbonyl, Aryloxy-carbonyl, Aminocarbonyl, ggf. substituiertes Mono- oder
- 15 Dialkylaminocarbonyl bzw. Mono- oder Diarylaminocarbonyl bzw. N-Alkyl-N-arylaminocarbonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkoxycarbonylamino, Cycloalkoxycarbonylamino, Aryloxycarbonylamino, Halogen,
- 20 Haloalkyl, Haloalkoxy, Haloalkylthio, Haloalkylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl, Haloalkylaminocarbonyl, Haloalkoxy-carbonylamino, Cyano oder Nitro;
- 25 R⁴, R⁵ können gemeinsam eine fünf- oder sechsgliedrige, gesättigte oder ungesättigte, aromatische oder nicht aromatische, ggf. subst. Alkylen-, Alkenylen- oder Alkdiénylenkette bilden;
- 30 R⁸ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰;
 R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
 R¹⁰ C₁-C₄-Alkyl;

Bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel 1, in der

35 R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2a



2a

steht, in der Z und die Substituenten R⁴-R⁷ die unter der allge-

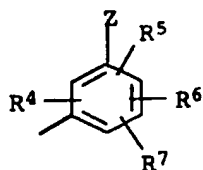
45 meinen Formel 2 angegebene oder die folgende Bedeutung haben:

- 2 5- oder 6-gliedrige heterocyclische, gesättigte oder ungesättigte Reste, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano,
- 5 Nitro, eine Gruppe $-CO-R^8$, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Haloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Haloalkoxy, C_1-C_4 -Alkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, Di- C_1-C_4 -Alkyl-amino, ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Haloalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxo-
- 10 gruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Haloalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus
- 15 oder einem ankondensierten, ggf. durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl, Di- C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Haloalkoxy, oder C_1-C_4 -Haloalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet;
- 20 R^4-R^7 können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkenyl, Cycloalkylalkinyl, Aryl, Arylalkyl, Arylalkenyl, Arylalkinyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkoxy, Cy-
- 25 cloalkylalkoxy, Cycloalkylalkenyloxy, Cycloalkylalkinyloxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Arylalkoxy, Arylalkenyloxy, Arylalkinyloxy, Thio, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkylalkylthio, Cycloalkylalkenylthio, Cycloalkylalkinylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Arylalkylthio, Arylalkenylthio, Arylalkinylthio, Amino, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-aryl-
- 30 lamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, Cycloalkenylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkenylsulfonyl, Alkinylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Cycloalkylalkylsulfonyl, Cycloalkylalkenylsulfonyl, Cycloalkylalkinylsulfonyl, Arylsulfonyl, Arylalkylsulfonyl, Arylalkenylsulfonyl, Arylalkinylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkyl-
- 40 sulfoxyl, Alkenylsulfoxyl, Alkinylsulfoxyl, Cycloalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkenylsulfoxyl, Cycloalkylalkinylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Arylalkylsulfoxyl, Arylalkenylsulfoxyl, Arylalkinylsulfoxyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminosulfonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylaminosulfonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminosulfonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder
- 45 verschieden sein können, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl,

18

Alkynylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Cycloalkylalkenylcarbonyl, Cycloalkylalkinylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl, Arylalkenylcarbonyl, Arylalkinylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Cycloalkoxy-
 5 carbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Cycloalkylalkenyloxy-
 carbonyl, Cycloalkylalkinyloxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Arylalkenyloxycarbonyl, Arylalkinylo-
 xycarbonyl, Aminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder
 10 Dialkylaminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino-
 carbonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminocarbonyl, wobei
 Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, ggf.
 subst. Mono- oder Dialkylcarbonylamino, ggf. subst. Mono-
 oder Diarylcarbonylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylcar-
 15 bonylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden
 sein können, Alkoxyaminocarbonyl, Alkenyloxycarbonyl-
 amino, Alkinyloxycarbonylamino, Cycloalkoxycarbonylamino,
 Cycloalkylalkoxycarbonylamino, Cycloalkylalkenyloxy-carbo-
 20 nylamino, Cycloalkylalkinyloxycarbonylamino, Aryloxycar-
 bonylamino, Arylalkoxycarbonylamino, Arylalkenyloxy-carbo-
 nylamino, Arylalkinyloxycarbonylamino, Halogen, Halo-
 alkyl, Haloalkenyl, Haloalkinyl, Haloalkoxy, Haloalke-
 nyloxy, Haloalkinyloxy, Haloalkylthio, Haloalkenylthio,
 25 Haloalkinylthio, Haloalkylamino, Haloalkenylamino, Halo-
 alkinylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkenylsulfonyl, Ha-
 loalkinylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkenylsulfo-
 xyl, Haloalkinylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkenyl-
 carbonyl, Haloalkinylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl, Halo-
 alkenyloxycarbonyl, Haloalkinyloxycarbonyl, Haloalkylami-
 30 nocarbonyl, Haloalkenylaminocarbonyl, Haloalkinylamino-
 carbonyl, Haloalkoxycarbonylamino, Haloalkenyloxycarbony-
 lamino, Haloalkinyloxycarbonylamino, Cyano oder Nitro.

Weiterhin bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1,
 35 in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2b



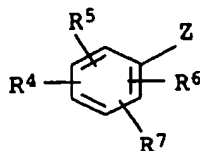
2b

45 steht, in der Z und die Substituenten R⁴-R⁷ die unter den allge-
 meinen Formeln 2 oder 2a angegebenen Bedeutungen haben.

19

Bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel 1, in der R^3 für einen Rest der allgemeinen Formel 2c

5



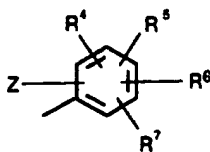
2c

10

steht, in der Z und die Substituenten R^4 - R^7 die unter den allgemeinen Formeln 2 oder 2a angegebenen Bedeutungen haben.

15 Darüber hinaus sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1 bevorzugt, in der R^3 einen Rest der allgemeinen Formel 2,

20

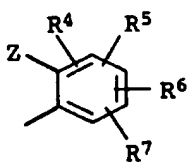


2

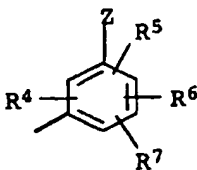
25

oder einen Rest der allgemeinen Formel 2a-c

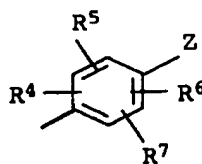
30



2a



2b



2c

35

bedeutet, in der Z die angegebene Bedeutung hat und die Substituenten R^4 bis R^7 die folgende Bedeutung haben:

40 R^4 - R^7 können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 2-Methylpropyl, Pentyl oder Hexyl; C_2 - C_6 -Alkenyl, bevorzugt Ethenyl, 2-Propenyl, 2-Butenyl oder 3-Butenyl; C_2 - C_6 -Alkynyl, Ethinyl, 2-Propinyl, 2-Butinyl oder 3-Butinyl; C_3 - C_6 -Cycloalkyl, bevorzugt Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl- C_2 - C_6 -alkenyl, C_3 - C_6 -Cy-

45

cloalkyl-C₂-C₆-alkinyl, Aryl, bevorzugt Phenyl oder Naphthyl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Aryl-C₂-C₆-alkenyl, Aryl-C₂-C₆-alkinyl; Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, bevorzugt Methyloxy, Ethyloxy, Propyloxy, 1-Methylethloxy, Butyloxy, Pentyloxy oder Hexyloxy, C₂-C₆-Alkenyloxy, bevorzugt Ethenyloxy, 2-Propenyloxy, 2-Butenyloxy oder 3-Butenyloxy; C₂-C₆-Alkinyloxy, bevorzugt Ethinyloxy, 2-Propinyloxy, 2-Butinyloxy oder 3-Butinyloxy; C₃-C₆-Cycloalkoxy, bevorzugt Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy oder Cyclohexyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinyloxy; Aryloxy, bevorzugt Phenoxy oder Naphthyloxy, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₂-C₆-alkenyloxy, Aryl-C₂-C₆-alkinyloxy; Thio; C₁-C₆-Alkylthio, bevorzugt Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, Pentylthio oder Hexylthio; C₂-C₆-Alkenylthio, bevorzugt Ethenylthio, 2-Propenylthio, 2-Butenylthio oder 3-Butenylthio; C₂-C₆-Alkinylthio, bevorzugt Ethinylthio, 2-Propinylthio, 2-Butinylthio oder 3-Butinylthio; C₃-C₆-Cycloalkylthio, bevorzugt Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio oder Cyclohexylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkenylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinylthio; Arylthio, bevorzugt Phenylthio oder Naphthylthio, Aryl-C₁-C₆-alkylthio, Aryl-C₂-C₆-alkenylthio, Aryl-C₂-C₆-alkinylthio; Amino, ggf. subst. Mono- oder Di-C₁-C₆-alkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-C₁-C₆-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können; Sulfonyl; C₁-C₆-Alkylsulfonyl, bevorzugt Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, Pentylsulfonyl oder Hexylsulfonyl; C₃-C₆-Cycloalkylsulfonyl, bevorzugt Cyclopropylsulfonyl, Cyclobutylsulfonyl, Cyclopentylsulfonyl oder Cyclohexylsulfonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-Alkenylsulfonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinylsulfonyl; Arylsulfonyl, bevorzugt Phenylsulfonyl oder Naphthylsulfonyl, Aryl-C₁-C₆-alkylsulfonyl, Aryl-C₂-C₆-alkenylsulfonyl, Aryl-C₂-C₆-alkinylsulfonyl; Sulfoxyl und ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminosulfonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylaminosulfonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminosulfonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, bevorzugt Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Propylcarbonyl, 1-Methylethylcarbonyl, Butylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl, Pentylcarbonyl oder Hexylcarbonyl; C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, bevorzugt Ethenylcarbonyl, 2-Propenylcarbonyl, 2-Butenylcarbonyl

21

- oder 3-Butenylcarbonyl; C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, bevorzugt Ethinylcarbonyl, 2-Propinylcarbonyl, 2-Butinylcarbonyl oder 3-Butinylcarbonyl; C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, bevorzugt Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentylcarbonyl oder Cyclohexylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinylcarbonyl; Arylcarbonyl, bevorzugt Phenylcarbonyl oder Naphthylcarbonyl, Aryl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, Aryl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl, Aryl-C₂-C₆-alkinylcarbonyl; Carboxyl; C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Methyloxy-carbonyl, Ethyloxy-carbonyl, Propyloxy-carbonyl, 1-Methylethyloxy-carbonyl, Butyloxy-carbonyl, Pentyloxy-carbonyl oder Hexyloxy-carbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-carbonyl, C₂-C₆-Alkinyloxy-carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy-carbonyl, Cyclopropyloxy-carbonyl, Cyclobutyloxy-carbonyl, Cyclopentyloxy-carbonyl oder Cyclohexyloxy-carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkenyloxy-carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinyloxy-carbonyl; Aryloxy-carbonyl, bevorzugt Phenyloxy-carbonyl oder Naphthyloxy-carbonyl, Aryl-C₁-C₆-alkoxy-carbonyl, Aryl-C₂-C₆-alkenyloxy-carbonyl, Aryl-C₂-C₆-alkinyloxy-carbonyl; Aminocarbonyl; ggf. subst. Mono- oder Di-C₁-C₆-alkylaminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylaminocarbonyl, ggf. subst.
- N-C₁-C₆-Alkyl-N-arylaminocarbonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, ggf. subst. Mono- oder Di-C₁-C₆-alkylcarbonylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylcarbonylamino, ggf. subst. N-C₁-C₆-Alkyl-N-arylcarbonylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, C₁-C₆-Alkoxyaminocarbonyl, bevorzugt Methyloxyaminocarbonyl, Ethyloxyaminocarbonyl, Propyloxyaminocarbonyl, 1-Methylethyloxyaminocarbonyl, Butyloxyaminocarbonyl, 2-Methylpropyloxyaminocarbonyl, Pentyloxyaminocarbonyl oder Hexyloxyaminocarbonyl; C₂-C₆-Alkenyloxy-carbonylamino, bevorzugt Ethylenoxyaminocarbonyl, 2-Propenyloxyaminocarbonyl, 2-Butenyloxyaminocarbonyl oder 3-Butenyloxyaminocarbonyl; C₂-C₆-Alkinyloxy-carbonylamino, bevorzugt Ethinyloxyaminocarbonyl, 2-Propinyloxyaminocarbonyl, 2-Butinyloxyaminocarbonyl oder 3-Butinyloxyaminocarbonyl; C₃-C₆-Cycloalkoxy-aminocarbonyl, bevorzugt Cyclopropyloxyaminocarbonyl, Cyclobutyloxyaminocarbonyl, Cyclopentyloxyaminocarbonyl oder Cyclohexyloxyaminocarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkoxyaminocarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkenyloxyaminocarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₂-C₆-alkinyloxyaminocarbonyl; Aryloxyaminocarbonyl, bevorzugt Phenyloxyaminocarbonyl oder Naphthyloxyaminocarbonyl, Aryl-C₁-C₆-alkoxyaminocarbonylamino,

22

Aryl-C₂-C₆-alkenyloxyaminocarbonyl, Aryl-C₂-C₆-alkinyloxyaminocarbonyl; Halogen, bevorzugt Fluor, Chlor, Brom oder Iod; C₁-C₆-Haloalkyl, bevorzugt Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Tri-
 5 fluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-difluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl oder Pentafluorethyl, C₂-C₆-Haloalkenyl, C₂-C₆-Haloalkinyl; C₁-C₆-Haloalkoxy, bevorzugt Chlor-
 10 methyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy oder Pentafluorethoxy, C₂-C₆-Haloalkenyloxy, C₂-C₆-Haloalkinyloxy; C₁-C₆-Haloalkylthio, bevorzugt Chlormethylthio, Dichlormethylthio, Trichlor-
 15 methylthio, Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlorfluormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio oder Pentafluorethylthio, C₂-C₆-Haloalkenylthio, C₂-C₆-Haloalkinylthio; C₁-C₆-Haloalkylamino, bevorzugt Chlormethylamino, Dichlormethylamino, Trichlormethyl-
 20 methylamino, Fluormethylamino, Difluormethylamino, Trifluormethylamino, Chlorfluormethylamino, Dichlorfluormethylamino, Chlordifluormethylamino, 1-Fluorethylamino, 2-Fluorethylamino, 2,2-Difluorethylamino, 2,2,2-Trifluorethylamino, 2-Chlor-2-fluorethylamino, 2-Chlor-2,2-difluorethylamino, 2,2-Dichlor-2-fluorethylamino, 2,2,2-Trichlorethylamino oder Pentafluorethylamino, C₂-C₆-Haloalkenylamino, C₂-C₆-Haloalkinylamino, C₁-C₆-Haloalkylsulfonyl, bevorzugt Chlormethylsulfonyl, Dichlormethylsulfonyl, Trichlormethylsulfonyl, Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlorfluormethylsulfonyl, Dichlorfluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl 1-Fluorethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl oder Pentafluorethylsulfonyl, C₂-C₆-Haloalkenylsulfonyl, C₂-C₆-Haloalkinylsulfonyl; C₁-C₆-Haloalkylcarbonyl, bevor-
 45

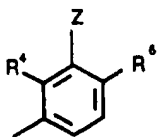
23

- zugt Chlormethylcarbonyl, Dichlormethylcarbonyl, Tri-chlormethylcarbonyl, Fluormethylcarbonyl, Difluormethylcarbonyl, Trifluormethylcarbonyl, Chlorfluormethylcarbonyl, Dichlorfluormethylcarbonyl, Chlordifluormethylcarbonyl, 1-Fluorethylcarbonyl, 2-Fluorethylcarbonyl, 2,2-Difluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trifluorethylcarbonyl, 2-Chlor-2-fluor-ethylcarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylcarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluor-ethylcarbonyl, 2-2-2-Trichlorethylcarbonyl oder Pentafluorethylcarbonyl,
- C₂-C₆-Haloalkenylcarbonyl, C₂-C₆-Haloalkinylcarbonyl; C₁-C₆-Haloalkoxycarbonyl, bevorzugt Chlormethyloxycarbonyl, Dichlormethyloxycarbonyl, Trichlormethyloxycarbonyl, Fluormethyloxycarbonyl, Difluormethyloxycarbonyl, Trifluormethyloxycarbonyl, Chlorfluormethyloxycarbonyl, Dichlorfluormethyloxycarbonyl, Chlordifluormethyloxycarbonyl, 1-Fluorethyloxycarbonyl, 2-Fluorethyloxycarbonyl, 2,2-Difluor-ethyloxycarbonyl, 2,2,2-Trifluorethyloxycarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethyl-oxycarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyloxycarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluor-ethyloxycarbonyl, 2,2,2-Trichlorethyloxycarbonyl oder Pentafluor-ethyloxycarbonyl, C₂-C₆-Haloalkenyloxycarbonyl, C₂-C₆-Haloalkinyloxycarbonyl; C₁-C₆-Haloalkylaminocarbonyl, bevorzugt Chlormethylaminocarbonyl, Dichlormethylaminocarbonyl, Trichlormethylaminocarbonyl, Fluormethylaminocarbonyl, Difluormethylaminocarbonyl, Trifluormethylaminocarbonyl, Chlorfluormethylaminocarbonyl, Dichlorfluormethylaminocarbonyl, Chlordifluormethylaminocarbonyl, 1-Fluor-ethylaminocarbonyl, 2-Fluorethylaminocarbonyl, 2,2-Difluorethylamino-carbonyl, 2,2,2-Trifluorethylamino-carbonyl, 2-Chlor-2-fluorethylamino-carbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylaminocarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluor-ethylaminocarbonyl, 2,2,2-Trichlorethylaminocarbonyl oder Pentafluorethylaminocarbonyl, C₂-C₆-Haloalkenylaminocarbonyl, C₂-C₆-Haloalkinylaminocarbonyl; C₁-C₆-Haloalkoxyaminocarbonyl, Dichlormethyloxyaminocarbonyl, Trichlormethyloxyaminocarbonyl, Fluormethyloxyaminocarbonyl, Difluormethyloxyaminocarbonyl, Trifluormethyloxyaminocarbonyl, Chlorfluormethyloxyaminocarbonyl, Dichlorfluormethyloxyaminocarbonyl, Chlordifluormethyloxyaminocarbonyl, 1-Fluorethyl-oxaminocarbonyl, 2-Fluorethyloxyaminocarbonyl, 2,2-Difluorethyloxyaminocarbonyl, 2,2,2-Trifluorethyloxyaminocarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethyloxyaminocarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyloxyaminocarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyloxyaminocarbonyl, 2,2,2-Trichlorethyloxyaminocarbonyl oder Pentafluorethyloxyaminocarbonyl,

24

C₂-C₆-Haloalkenyloxycarbonylamino, C₂-C₆-Haloalkinyloxy-carbonylamino, Cyano oder Nitro.

Außerdem sind Verbindungen der allgemeinen Formel 1 besonders 5 bevorzugt, in der R³ einen Rest der allgemeinen Formel 2d



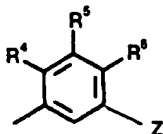
10

2d

15 bedeutet, wobei R⁴ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Alkyl, bevorzugt Methyl oder Ethyl, Alkylsulfonyl, bevorzugt Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl; Halogen, bevorzugt Fluor, Chlor oder Brom, Haloalkyl, bevorzugt Difluor-methyl, Trifluormethyl, Tetrafluorethyl oder Trichlormethyl ste-
20 hen.

Bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel 1, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2e

25



30

2e

steht und R⁴, R⁵ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Alkyl, bevorzugt Methyl oder Ethyl, Alkoxy, 35 bevorzugt Methoxy, Ethoxy oder Aryloxy, bevorzugt Phenoxy; Alkylsulfonyl, bevorzugt Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl; Halogen, bevorzugt Fluor, Chlor, Brom oder Iod; Haloalkyl, bevorzugt Difluormethyl, Trifluormethyl, Tetrafluorethyl oder Trichlor-methyl stehen.

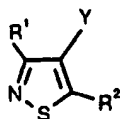
40

Bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel 1, in denen die Substituenten aus einer Kombination der oben aufgeführten bevorzugten Substituenten ausgewählt sind.

45 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 sind

25

- a) durch Umsetzung der Isothiazolhalogenverbindungen 3

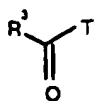


3

10

in der R^1 und R^2 die oben beschriebene Bedeutung haben und Y Halogen bevorzugt Chlor, Brom oder Iod bedeutet mit elementarem Magnesium, einer magnesiumorganischen oder einer lithiumorganischen Verbindung und einem Carbonsäurederivat der allgemeinen Formel 4

15



20

4

25

in der R^3 die oben beschriebene Bedeutung hat und T Halogen, bevorzugt Chlor, Brom oder Iod oder N-Alkoxy-N-alkylamino, bevorzugt N-Methoxy-N-methyl oder Cyano bedeutet in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels in einem Temperaturbereich von -78°C bis 111°C , bevorzugt in einem Temperaturbereich von -20°C bis 111°C (A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, M. C. Sanudo, Synth. Commun. 17 (1987)1207), oder

30

- b. durch Umsetzung eines Halogenbenzols der allgemeinen Formel 5



35

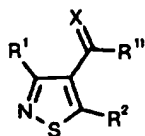
5

40

in der R^3 die oben beschriebene Bedeutung hat und Y Halogen, bevorzugt Chlor, Brom oder Iod bedeutet mit elementarem Magnesium, einer magnesiumorganischen oder einer lithiumorganischen Verbindung und einem Isothiazolcarbonsäurederivat der allgemeinen Formel 6a oder 6b,

45

5



6a



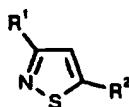
6b

- 10 in der X, R¹ und R² die oben beschriebene Bedeutung haben und
 R¹ Halogen, bevorzugt Chlor, Brom oder Iod und N-Alkoxy-N-alkylamino, bevorzugt N-Methoxy-N-Methyl bedeutet in Gegenwart
 eines inerten Lösungsmittels in einem Temperaturbereich von
 -78°C bis 111°C, bevorzugt in einem Temperaturbereich von
 -20°C bis 111°C zugänglich (A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, M. C. Sanudo, J. Heterocyclic Chem. 25 (1988) 235).

15

Die Synthese der Isothiazolhalogenverbindungen 3 erfolgt durch Halogenierung nach literaturbekannten Verfahren (stellvertretend: a. A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, M. C. Sanudo, Synth. Commun. 17 (1987) 1207; b. Vasilevskii, Izv. Akad. Nauk. SSSR Ser. Khim. (1975) 616) von Isothiazolverbindungen der allgemeinen Formel 7

25



7

- 30 in der R¹ und R² die oben beschriebene Bedeutung haben.

Isothiazolverbindungen der allgemeinen Formel 7 sind prinzipiell bekannt und werden entsprechend literaturbekannter Methoden dargestellt (stellvertretend: a. D. N. McGregor, U. Corbin, J. E. Swigor, I. C. Cheney, Tetrahedron 25 (1968) 389; b. F. Lucchesini, N. Picci, M. Pocci, Heterocycles 29 (1989) 97).

35

Die Synthese der Isothiazolcarbonsäurederivate der allgemeinen Formel 6b erfolgt durch Umsetzung der Isothiazolhalogenverbindungen 3 mit anorganischen Cyaniden, wie beispielsweise Kupfer(I)cyanid nach literaturbekannten Verfahren (stellvertretend: A. Alberola, F. Alonso, P. Cuadrado, M. C. Sanudo, J. Heterocyclic Chem. 25 (1988) 235). Die entsprechenden Isothiazolcarbonsäurederivate der allgemeinen Formel 6a können nach literaturbekannten Methoden von Isothiazolcarbonsäurederivaten der allgemeinen Formel 6b ausgehend dargestellt werden.

45

27

Bevorzugte magnesiumorganische Verbindungen sind Alkylmagnesiumhalogenide, wie beispielsweise Methyl- oder Ethylmagnesiumbromid oder -chlorid. Als lithiumorganische Verbindungen kommen bevorzugt aliphatische Lithiumverbindungen, wie Lithiumdiisopropylamid, n-Butyl- oder sekundär Butyllithium in Frage.

Das organische Lösungsmittel wird in Abhängigkeit der eingesetzten Edukte ausgewählt. Im allgemeinen ist jedes inerte Lösungsmittel geeignet. Bevorzugte inerte Lösungsmittel stellen aliphatische, cyclische oder acyclische Ether, wie beispielsweise Diethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan oder 1,2-Dimethoxyethan dar. Darüber hinaus finden auch inerte aromatische Lösungsmittel, wie Benzol oder Toluol Verwendung.

Die Edukte werden üblicherweise in stöchiometrischen Mengen miteinander umgesetzt. Es kann jedoch, beispielsweise zur Steigerung der Ausbeute vorteilhaft sein, eines der Edukte in einem Überschuß von 0.1 bis 10 mol-Äquivalenten einzusetzen.

Benzoessäurederivate der Formel 4 lassen sich folgendermaßen herstellen:

Benzoylhalogenide wie beispielsweise Benzoylchloride der Formel 4 (T = Cl) werden in bekannter Weise durch Umsetzung der Benzoesäuren der Formel 4 (T = OH) mit Thionylchlorid hergestellt.

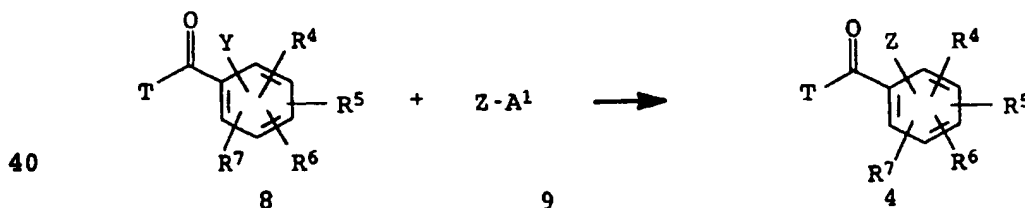
Die Benzoesäuren der Formel 4 (T = OH) können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel 4 (T = C₁-C₄-Alkoxy) hergestellt werden.

30

Die Zwischenprodukte der Formel 4 lassen sich z.B. gemäß Schema 1 und 2 auf den im folgenden beschriebenen Wegen darstellen.

Schema 1

35



T C₁-C₄-Alkoxy,

Y Cl, Br, J, -OS(O)₂CF₃, -OS(O)₂F

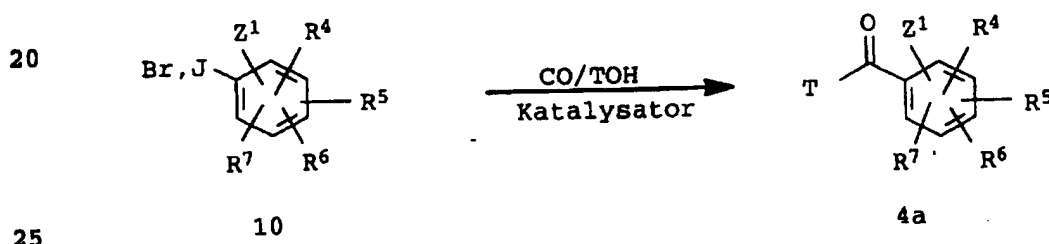
45 A¹ Sn(C₁-C₄-Alkyl)₃, B(OH)₂, ZnHal, wobei Hal für Cl oder Br steht

2 und die Substituenten R^4 , R^5 , R^6 und R^7 wie oben definiert.

Danach lassen sich die Arylhalogenverbindungen oder Aryl-
 5 sulfonate 8 in bekannter Weise mit Heteroarylstannanen (Stille-Kupplungen), Heteroaryl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heteroaryl-Zinkverbindungen (Negishi-Reaktion) V (vgl. z.B. Synthesis 1987, 51-53, Synthesis 1992, 413) in Gegenwart eines
 10 Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base zu den neuen Verbindungen der allgemeinen Formel 4 umsetzen.

Die Benzoessäurederivate der Formel 4a können auch erhalten werden, indem man entsprechende brom- oder iodsubstituierte
 15 Verbindungen der Formel 10

Schema 2

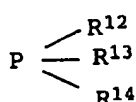


Z^1 Z oder CN
 T OH, C_1 - C_4 -Alkoxy

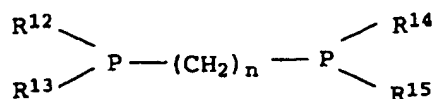
30 in der die Substituenten R^4 , R^5 , R^6 und R^7 die obengenannte Bedeutung haben, in Gegenwart eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetallkatalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter erhöhtem Druck umgesetzt.

35 Die Katalysatoren Nickel, Cobalt, Rhodium und insbesondere Palladium können metallisch oder in Form üblicher Salze wie in Form von Halogenverbindungen, z.B. $PdCl_2$, $RhCl_3 \cdot H_2O$, Acetaten, z.B. $Pd(OAc)_2$, Cyaniden usw. in den bekannten Wertigkeitsstufen vorliegen. Ferner können Metallkomplexe mit tertiären Phosphinen,
 40 Metallalkylcarbonyle, Metallcarbonyle, z.B. $CO_2(CO)_8$, $Ni(CO)_4$, Metallcarbonyl-Komplexe mit tertiären Phosphinen, z.B. $(PPh_3)_2Ni(CO)_2$, oder mit tertiären Phosphinen komplexierte Übergangsmetallsalze vorliegen. Die letztgenannte Ausführungsform ist insbesondere im Fall von Palladium als Katalysator bevorzugt.
 45 Dabei ist die Art der Phosphinliganden breit variabel. Beispielsweise lassen sie sich durch folgende Formeln wiedergeben:

29



oder



5

- wobei n die Zahlen 1, 2, 3 oder 4 bedeutet und die Reste R¹² bis R¹⁵ für niedermolekulares Alkyl, z.B. C₁-C₆-Alkyl, Aryl, C₁-C₄-Alkylaryl, z.B. Benzyl, Phenethyl oder Aryloxy stehen. Aryl ist z.B. Naphthyl, Anthryl und vorzugsweise gegebenenfalls substituiertes Phenyl, wobei man hinsichtlich der Substituenten nur auf deren Inertheit gegenüber der Carboxylierungsreaktion zu achten hat, ansonsten können sie breit variiert werden und umfassen alle inerten C-organischen Reste wie C₁-C₆-Alkylreste, z.B. Methyl, Carboxylreste wie COOH, COOM (M ist z.B. ein Alkali-, Erdalkalimetall oder Ammoniumsalz), oder C-organische Reste über Sauerstoff gebunden wie C₁-C₆-Alkoxyreste.

- Die Herstellung der Phosphinkomplexe kann in bekannter Weise, z.B. wie in den eingangs genannten Dokumenten beschrieben, erfolgen. Beispielsweise geht man von üblichen kommerziell erwerblichen Metallsalzen wie PdCl₂ oder Pd(OCOCH₃)₂ aus und fügt das Phosphin z.B. P(C₆H₅)₃, P(n-C₄H₉)₃, PCH₃(C₆H₅)₂, 1,2-Bis(diphenylphosphino)ethan hinzu.

- Die Menge an Phosphin, bezogen auf das Übergangsmetall, beträgt üblicherweise 0 bis 20, insbesondere 0,1 bis 10 Moläquivalente, besonders bevorzugt 1 bis 5 Moläquivalente.

- Die Menge an Übergangsmetall ist nicht kritisch. Natürlich wird man aus Kostengründen eher eine geringe Menge, z.B. von 0,1 bis 10 Mol.-%, insbesondere 1 bis 5 Mol.-%, bezogen auf den Ausgangsstoff der Formel 4 verwenden.

- Zur Herstellung der Benzoesäuren 4 (T = OH) führt man die Umsetzung mit Kohlenmonoxid und mindestens äquimolaren Mengen an Wasser, bezogen auf die Ausgangsstoffe 10 durch. Der Reaktionspartner Wasser kann gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen, d.h. die maximale Menge ist nicht kritisch.

- Es kann aber auch je nach Art der Ausgangsstoffe und der verwendeten Katalysatoren von Vorteil sein, anstelle des Reaktionspartners ein anderes inertes Lösungsmittel oder die für die Carboxylierung verwendete Base als Lösungsmittel zu verwenden.

- Als inerte Lösungsmittel kommen für Carboxylierungsreaktionen übliche Lösungsmittel wie Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Hexan, Pentan, Cyclohexan, Ether z.B. Methyl-tert.butylether,

30

Tetrahydrofuran, Dioxan, Dimethoxyethan, substituierte Amide wie Dimethylformamid, persubstituierte Harnstoffe wie Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoffe oder Nitrile wie Benzonitril oder Acetonitril in Betracht.

5

In einer bevorzugten Ausführungsform des Verfahrens verwendet man einen der Reaktionspartner, insbesondere die Base, im Überschuß, so daß kein zusätzliches Lösungsmittel erforderlich ist.

- 10 Für das Verfahren geeignete Basen sind alle inerten Basen, die den bei der Umsetzung freiwerdenden Jodwasserstoff bzw. Bromwasserstoff zu binden vermögen. Beispielsweise sind hier tertiäre Amine wie tert.-Alkylamine, z.B. Trialkylamine wie Triethylamin, cyclische Amine wie N-Methylpiperidin oder N,N'-Dimethyl-
- 15 piperazin, Pyridin, Alkali- oder -hydrogencarbonate, oder tetraalkylsubstituierte Harnstoffderivate wie Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoff, z.B. Tetramethylharnstoff, zu nennen.

- Die Menge an Base ist nicht kritisch, üblicherweise werden 1 bis
- 20 10, insbesondere 1 bis 5 Mol verwendet. Bei gleichzeitiger Verwendung der Base als Lösungsmittel, wird die Menge in der Regel so bemessen, daß die Reaktionspartner gelöst sind, wobei man aus Praktikabilitätsgründen unnötig hohe Überschüsse vermeidet, um Kosten zu sparen, kleine Reaktionsgefäße einsetzen zu können und
- 25 den Reaktionspartnern maximalen Kontakt zu gewährleisten.

- Während der Umsetzung wird der Kohlenmonoxiddruck so eingestellt, daß immer ein Überschuß an CO, bezogen auf die Verbindung der Formel 10 vorliegt. Vorzugsweise liegt der Kohlenmonoxiddruck bei
- 30 Raumtemperatur bei 1 bis 250 bar, insbesondere 5 bis 150 bar CO.

- Die Carbonylierung wird in der Regel bei Temperaturen von 20 bis 250°C, insbesondere bei 30 bis 150°C kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt. Bei diskontinuierlichem Betrieb wird
- 35 zweckmäßigerweise zur Aufrechterhaltung eines konstanten Druckes kontinuierlich Kohlenmonoxid auf das Umsetzungsgemisch aufgebracht.

- Die als Ausgangsverbindungen benutzten Arylhalogenverbindungen
- 40 der Formel 10 sind bekannt oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

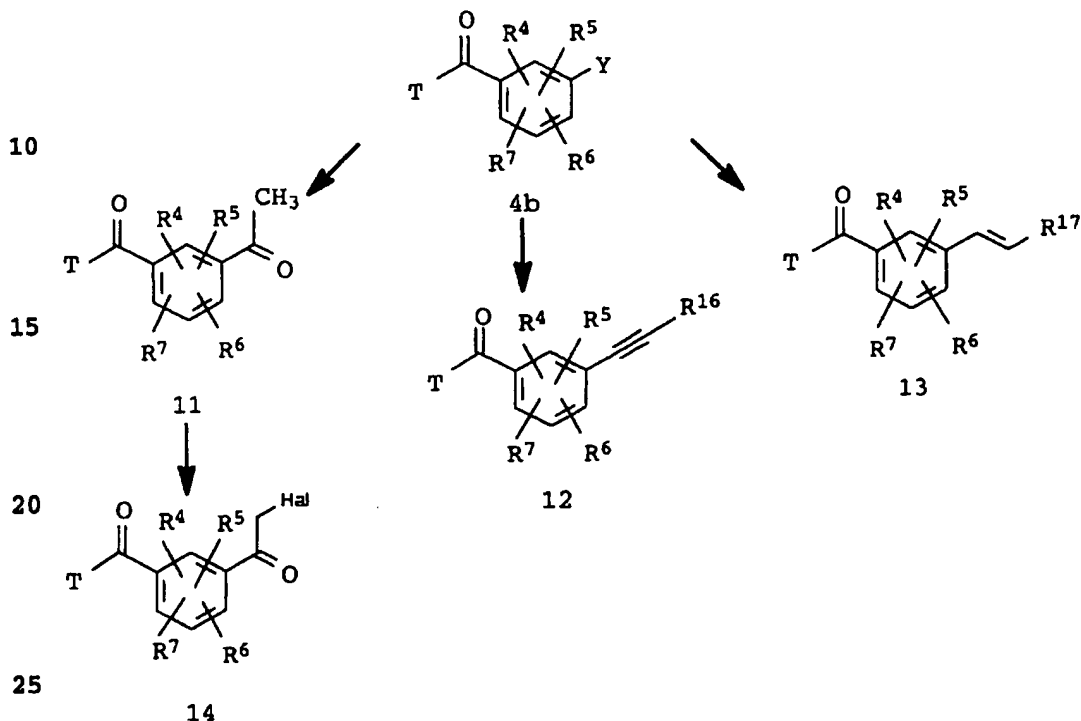
- Beispielsweise können die Halogenverbindungen 10 durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrer-
- 45 seits durch Reduktion von geeigneten Nitroverbindungen (vgl. z.B. für Verbindung 10 mit Z¹ = CN: Liebigs Ann. Chem. 1980, 768-778) synthetisiert werden. Die Arylbromide 10 können außerdem durch

31

direkte Bromierung geeigneter Ausgangsverbindungen erhalten werden [vgl. z.B. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)].

Schema 3

5



T C₁-C₄-Alkoxy

Y Cl, Br, J, -OS(O)₂CF₃, -OS(O)₂F

30 Z, R⁴-R⁷ wie oben definiert

R¹⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, ggf. subst. Phenyl oder Trimethylsilyl,

R¹⁷ Wasserstoff, C₁-C₄-Haloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder ggf. subst. Phenyl.

35

Ausgehend von den Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten 8 lassen sich in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base Arylmethylketone 11 nach literaturbekannten Verfahren durch Umsetzung mit Vinylalkylethern und anschließende Hydrolyse herstellen [vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 32, 1753-1756 (1991)].

Die ethinylierten Aromaten 12 können in bekannter Weise durch Umsetzung von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten 8 mit substituierten Acetylenen in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators hergestellt werden (z.B. Heterocycles, 24, 31-32 (1986)). Derivate 12 mit R¹⁶= H erhält man

45

32

zweckmäßigerweise aus den Silylverbindungen 12, $R^{16} = -Si(CH_3)_3$ [J.Org.Chem. 46, 2280-2286 (1981)].

Durch Heck-Reaktion von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten 4b mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators werden die Arylalkene 13 erhalten (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Press, London 1985 bzw. Synthesis 1993, 735-762).

10 Die als Ausgangsverbindungen benutzten Benzoylderivate 4b sind bekannt [vgl. z.B. Coll. Czech. Chem. Commun. 40, 3009-3019 (1975)] oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

15 Beispielsweise können die Sulfonate 4b ($Y = -OS(O)_2CF_3$, $-OS(O)_2F$) aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP 195247) oder nach bekannten Methoden hergestellt werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).

20 Die Halogenverbindungen 4b ($Y = Cl, Br$ oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden.

25

30

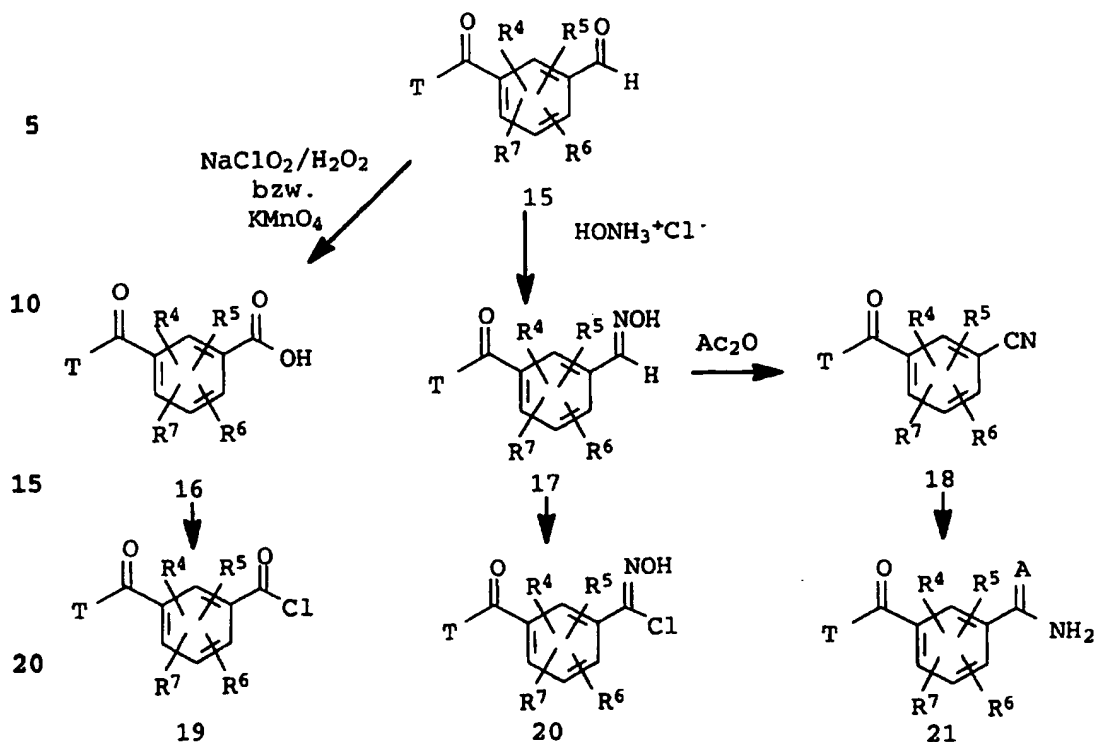
35

40

45

33

Schema 4



25 A S, NH oder NOH

T ist C₁-C₄-Alkoxy und Substituenten R⁴-R⁷ wie oben definiert.

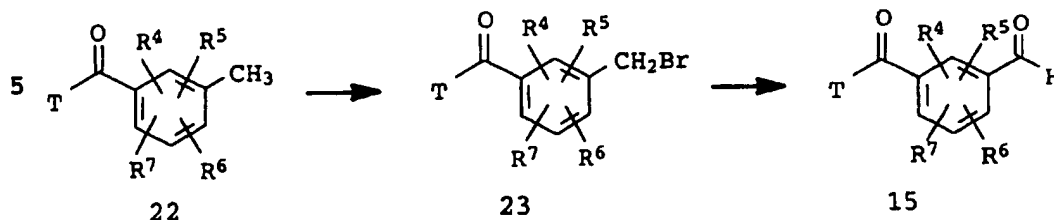
Isophthalsäurederivate 16 können aus den Aldehyden 15 nach bekannten Verfahren hergestellt werden [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 629ff, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Oxime 17 erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in bekannter Weise Aldehyde 15 mit Hydroxylamin umsetzt [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Umwandlung der Oxime 17 in Nitrile 18 kann ebenfalls nach bekannten Verfahren erfolgen [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 931-932, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die als Ausgangsverbindungen benötigten Aldehyde 15 sind bekannt oder nach bekannten Methoden herstellbar. Beispielsweise können sie gemäß Schema 5 aus den Methylverbindungen 22 synthetisiert werden.

Schema 5



10

Die Reste T und R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ haben die unter Schema 4 ge-
 nannte Bedeutung. Die Methylverbindungen 22 können nach allgemein
 bekannten Methoden, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder
 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, zu den Benzylbromiden 23 umge-
 15 setzt werden. Die Umsetzung von Benzylbromiden zu Benzaldehyden
 15 ist ebenfalls literaturbekannt [vgl. Synth. Commun. 22
 1967-1971 (1992)].

Die Vorprodukte 11 bis 18 eignen sich zum Aufbau heterocyclischer
 20 Zwischenprodukte 4.

Beispielsweise können aus den Acetophenonen 11 über die
 halogenierte Zwischenstufe 14 5-Oxazolyl- [vgl. z.B. J. Hetero-
 cyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] oder 4-Thiazolyl-derivate [vgl.
 25 z.B. Metzger, Thiazoles in: The Chemistry of Heterocyclic
 Compounds, Vol.34 S. 175ff (1976)] erhalten werden.

Die Acetylene 12 bzw. die Alkene 13 eignen sich zum Aufbau von
 4-Isoxazolyl-, 5-Isoxazolyl-, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl-, 4,5-Di-
 30 hydroisoxazol-5-yl-derivaten [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der
 organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

Aus den Benzoesäuren 16 bzw. den daraus nach Standardverfahren
 erhältlichen Säurechloriden 19 können beispielsweise nach
 35 literaturbekannten Verfahren 2-Oxazolyl-, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl-,
 1,3,4-Oxadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem.,
 28, 17-28 (1991)] oder 2-Pyrrolyl-derivate [vgl. z.B. Hetero-
 cycles 26, 3141-3151 (1987)] hergestellt werden.

40 1,2,4-Triazol-3-yl-derivate sind aus Benzonitrilen 18 nach be-
 kannten Methoden [vgl. z.B. J. Chem. Soc. 3461-3464 (1954)] her-
 zustellen.

Die Benzonitrile 18 können über die Zwischenstufe der Thioamide,
 45 Amidoxime oder Amdine 21 in 1,2,4-Oxadiazol-3-yl- [vgl. z.B. J.
 Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] 2-Thiazolyl-, 4,5-Dihydro-
 thiazol-2-yl- oder 5,6-Dihydro-4-H-1,3-thiazin-2-yl-derivate

35

[vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. E5, S. 1268ff (1985)] umgewandelt werden. Aus den Thioamiden 21 (A=S) sind nach literaturbekannten Verfahren auch 1,2,4-Thiadiazol-5-yl-derivate [vgl. z.B. J.Org.Chem. 45 3750-3753 (1980)] oder 1,3,4-Thiadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Chem.Soc., Perkin Trans. I 1987-1991 (1982)] erhältlich.

Die Umwandlung von Oximen 17 in 3-Isoxazolyl-derivate kann in bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäurechloride 20 erfolgen [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

Beispiele für besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel 1 sind in den folgenden Tabellen zusammengestellt. Die Definitionen der Reste gelten nicht nur in der speziellen Kombination von Resten als besonders bevorzugt, sondern auch jeweils isoliert betrachtet.

20

25

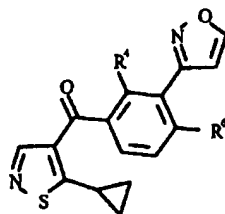
30

35

40

45

Tabelle 1:



24

No.	R'	R''
24.1	Cl	F
24.2	Cl	Cl
24.3	Cl	Br
24.4	Cl	CH ₃
24.5	Cl	C ₂ H ₅
24.6	Cl	nC ₃ H ₇
24.7	Cl	iC ₃ H ₇
24.8	Cl	nC ₄ H ₉
24.9	Cl	tC ₄ H ₉
24.10	Cl	Ph
24.11	Cl	OH
24.12	Cl	OCH ₃
24.13	Cl	OC ₂ H ₅
24.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
24.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
24.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
24.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
24.18	Cl	OPh
24.19	Cl	SH
24.20	Cl	SCH ₃
24.21	Cl	SC ₂ H ₅
24.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
24.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
24.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
24.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

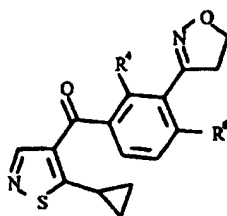
No.	R ²	R ¹
24.26	Cl	SPh
24.27	Cl	CCl ₃
24.28	Cl	CH ₂ F
24.29	Cl	CHF ₂
24.30	Cl	CF ₃
24.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
24.32	Cl	SO ₃ H
24.33	Cl	SO ₂ CH ₃
24.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
24.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.39	Cl	SO ₂ Ph
24.40	Cl	NH ₂
24.41	Cl	NHCH ₃
24.42	Cl	NCH ₃ Ph
24.43	Cl	N(CH ₃) ₂
24.44	Cl	NPh ₂
24.45	Cl	CN
24.46	Cl	NO ₂
24.47	CH ₃	F
24.48	CH ₃	Cl
24.49	CH ₃	Br
24.50	CH ₃	CH ₃
24.51	CH ₃	C ₂ H ₅
24.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
24.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
24.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
24.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
24.57	CH ₃	Ph
24.58	CH ₃	OH
24.59	CH ₃	OCH ₃

No.	R ¹	R ²
24.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
24.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.65	CH ₃	OPh
24.66	CH ₃	SH
24.67	CH ₃	SCH ₃
24.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
24.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.73	CH ₃	SPh
24.74	CH ₃	CCl ₃
24.75	CH ₃	CH ₂ F
24.76	CH ₃	CHF ₂
24.77	CH ₃	CF ₃
24.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
24.79	CH ₃	SO ₃ H
24.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
24.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
24.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.86	CH ₃	SO ₂ Ph
24.87	CH ₃	NH ₂
24.88	CH ₃	NHCH ₃
24.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
24.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
24.91	CH ₃	NPh ₂
24.92	CH ₃	CN

No.	R ¹	R ²
24.93	CH ₃	NO ₂
24.94	SO ₂ CH ₃	F
24.95	SO ₂ CH ₃	Cl
24.96	SO ₂ CH ₃	Br
24.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
24.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
24.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
24.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
24.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
24.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
24.103	SO ₂ CH ₃	Ph
24.104	SO ₂ CH ₃	OH
24.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
24.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
24.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.111	SO ₂ CH ₃	OPh
24.112	SO ₂ CH ₃	SH
24.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
24.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
24.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.119	SO ₂ CH ₃	SPh
24.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
24.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
24.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
24.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
24.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
24.125	SO ₂ CH ₃	SO ₂ H

Nr.	R ¹	R ²
24.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
24.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
24.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
24.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
24.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
24.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
24.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
24.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
24.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
24.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
24.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
24.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
24.138	SO ₂ CH ₃	CN
24.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 2:



25

Nr.	R'	R''
25.1	Cl	F
25.2	Cl	Cl
25.3	Cl	Br
25.4	Cl	CH ₃
25.5	Cl	C ₂ H ₅
25.6	Cl	nC ₃ H ₇
25.7	Cl	iC ₃ H ₇
25.8	Cl	nC ₄ H ₉
25.9	Cl	tC ₄ H ₉
25.10	Cl	Ph
25.11	Cl	OH
25.12	Cl	OCH ₃
25.13	Cl	OC ₂ H ₅
25.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
25.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
25.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
25.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
25.18	Cl	OPh
25.19	Cl	SH
25.20	Cl	SCH ₃
25.21	Cl	SC ₂ H ₅
25.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
25.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
25.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
25.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

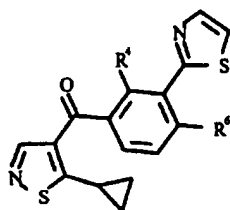
Nr.	R ¹	R ²
25.26	Cl	SPh
25.27	Cl	CCl ₃
25.28	Cl	CH ₂ F
25.29	Cl	CHF ₂
25.30	Cl	CF ₃
25.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
25.32	Cl	SO ₃ H
25.33	Cl	SO ₂ CH ₃
25.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
25.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.39	Cl	SO ₂ Ph
25.40	Cl	NH ₂
25.41	Cl	NHCH ₃
25.42	Cl	NCH ₃ Ph
25.43	Cl	N(CH ₃) ₂
25.44	Cl	NPh ₂
25.45	Cl	CN
25.46	Cl	NO ₂
25.47	CH ₃	F
25.48	CH ₃	Cl
25.49	CH ₃	Br
25.50	CH ₃	CH ₃
25.51	CH ₃	C ₂ H ₅
25.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
25.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
25.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
25.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
25.57	CH ₃	Ph
25.58	CH ₃	OH
25.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ^a	R ^b
25.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
25.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.64	CH ₃	O(C ₄ H ₉)
25.65	CH ₃	OPh
25.66	CH ₃	SH
25.67	CH ₃	SCH ₃
25.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
25.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.73	CH ₃	SPh
25.74	CH ₃	CCl ₃
25.75	CH ₃	CH ₂ F
25.76	CH ₃	CHF ₂
25.77	CH ₃	CF ₃
25.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
25.79	CH ₃	SO ₂ H
25.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
25.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
25.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.86	CH ₃	SO ₂ Ph
25.87	CH ₃	NH ₂
25.88	CH ₃	NHCH ₃
25.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
25.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
25.91	CH ₃	NPh ₂
25.92	CH ₃	CN

No.	R ¹	R ²
25.93	CH ₃	NO ₂
25.94	SO ₂ CH ₃	F
25.95	SO ₂ CH ₃	Cl
25.96	SO ₂ CH ₃	Br
25.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
25.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
25.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
25.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
25.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
25.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
25.103	SO ₂ CH ₃	Ph
25.104	SO ₂ CH ₃	OH
25.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
25.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
25.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.111	SO ₂ CH ₃	OPh
25.112	SO ₂ CH ₃	SH
25.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
25.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
25.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.119	SO ₂ CH ₃	SPh
25.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
25.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
25.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
25.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
25.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
25.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

Nr.	R ^a	R ^b
25.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
25.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
25.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
25.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
25.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
25.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
25.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
25.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
25.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
25.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
25.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
25.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
25.138	SO ₂ CH ₃	CN
25.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 3:



26

Nr.	R'	R''
26.1	Cl	F
26.2	Cl	Cl
26.3	Cl	Br
26.4	Cl	CH ₃
26.5	Cl	C ₂ H ₅
26.6	Cl	nC ₃ H ₇
26.7	Cl	iC ₃ H ₇
26.8	Cl	nC ₄ H ₉
26.9	Cl	tC ₄ H ₉
26.10	Cl	Ph
26.11	Cl	OH
26.12	Cl	OCH ₃
26.13	Cl	OC ₂ H ₅
26.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
26.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
26.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
26.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
26.18	Cl	OPh
26.19	Cl	SH
26.20	Cl	SCH ₃
26.21	Cl	SC ₂ H ₅
26.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
26.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
26.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
26.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

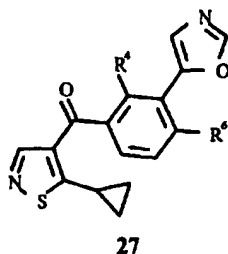
Nr.	R ¹	R ²
26.26	Cl	SPh
26.27	Cl	CCl ₃
26.28	Cl	CH ₂ F
26.29	Cl	CHF ₂
26.30	Cl	CF ₃
26.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
26.32	Cl	SO ₃ H
26.33	Cl	SO ₂ CH ₃
26.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
26.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
26.39	Cl	SO ₂ Ph
26.40	Cl	NH ₂
26.41	Cl	NHCH ₃
26.42	Cl	NCH ₃ Ph
26.43	Cl	N(CH ₃) ₂
26.44	Cl	NPh ₂
26.45	Cl	CN
26.46	Cl	NO ₂
26.47	CH ₃	F
26.48	CH ₃	Cl
26.49	CH ₃	Br
26.50	CH ₃	CH ₃
26.51	CH ₃	C ₂ H ₅
26.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
26.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
26.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
26.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
26.57	CH ₃	Ph
26.58	CH ₃	OH
26.59	CH ₃	OCH ₃

No.	R ¹	R ²
26.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
26.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
26.65	CH ₃	OPh
26.66	CH ₃	SH
26.67	CH ₃	SCH ₃
26.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
26.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
26.73	CH ₃	SPh
26.74	CH ₃	CCl ₃
26.75	CH ₃	CH ₂ F
26.76	CH ₃	CHF ₂
26.77	CH ₃	CF ₃
26.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
26.79	CH ₃	SO ₂ H
26.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
26.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
26.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
26.86	CH ₃	SO ₂ Ph
26.87	CH ₃	NH ₂
26.88	CH ₃	NHCH ₃
26.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
26.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
26.91	CH ₃	NPh ₂
26.92	CH ₃	CN

Nr.	R ¹	R ²
26.93	CH ₃	NO ₂
26.94	SO ₂ CH ₃	F
26.95	SO ₂ CH ₃	Cl
26.96	SO ₂ CH ₃	Br
26.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
26.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
26.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
26.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
26.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
26.102	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₄ H ₉
26.103	SO ₂ CH ₃	Ph
26.104	SO ₂ CH ₃	OH
26.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
26.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
26.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₄ H ₉)
26.111	SO ₂ CH ₃	OPh
26.112	SO ₂ CH ₃	SH
26.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
26.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
26.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₄ H ₉)
26.119	SO ₂ CH ₃	SPh
26.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
26.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
26.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
26.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
26.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
26.125	SO ₂ CH ₃	SO ₂ H

No.	R ¹	R ²
26.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
26.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
26.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
26.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
26.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
26.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
26.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
26.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
26.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
26.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
26.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
26.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
26.138	SO ₂ CH ₃	CN
26.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 4:



Nr.	R ₄	R ₆
27.1	Cl	F
27.2	Cl	Cl
27.3	Cl	Br
27.4	Cl	CH ₃
27.5	Cl	C ₂ H ₅
27.6	Cl	nC ₃ H ₇
27.7	Cl	iC ₃ H ₇
27.8	Cl	nC ₄ H ₉
27.9	Cl	tC ₄ H ₉
27.10	Cl	Ph
27.11	Cl	OH
27.12	Cl	OCH ₃
27.13	Cl	OC ₂ H ₅
27.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
27.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
27.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
27.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
27.18	Cl	OPh
27.19	Cl	SH
27.20	Cl	SCH ₃
27.21	Cl	SC ₂ H ₅
27.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
27.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
27.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
27.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

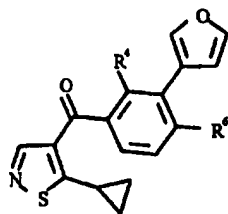
Nr.	R ¹	R ²
27.26	Cl	SPh
27.27	Cl	CCl ₃
27.28	Cl	CH ₂ F
27.29	Cl	CHF ₂
27.30	Cl	CF ₃
27.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
27.32	Cl	SO ₂ H
27.33	Cl	SO ₂ CH ₃
27.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
27.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
27.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
27.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
27.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
27.39	Cl	SO ₂ Ph
27.40	Cl	NH ₂
27.41	Cl	NHCH ₃
27.42	Cl	NCH ₃ Ph
27.43	Cl	N(CH ₃) ₂
27.44	Cl	NPh ₂
27.45	Cl	CN
27.46	Cl	NO ₂
27.47	CH ₃	F
27.48	CH ₃	Cl
27.49	CH ₃	Br
27.50	CH ₃	CH ₃
27.51	CH ₃	C ₂ H ₅
27.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
27.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
27.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
27.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
27.57	CH ₃	Ph
27.58	CH ₃	OH
27.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ¹	R ²
27.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
27.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
27.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
27.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
27.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
27.65	CH ₃	OPh
27.66	CH ₃	SH
27.67	CH ₃	SCH ₃
27.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
27.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
27.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
27.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
27.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
27.73	CH ₃	SPh
27.74	CH ₃	CCl ₃
27.75	CH ₃	CH ₂ F
27.76	CH ₃	CHF ₂
27.77	CH ₃	CF ₃
27.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
27.79	CH ₃	SO ₂ H
27.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
27.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
27.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
27.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
27.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
27.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
27.86	CH ₃	SO ₂ Ph
27.87	CH ₃	NH ₂
27.88	CH ₃	NHCH ₃
27.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
27.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
27.91	CH ₃	NPh ₂
27.92	CH ₃	CN

№	R ¹	R ²
27.93	CH ₃	NO ₂
27.94	SO ₂ CH ₃	F
27.95	SO ₂ CH ₃	Cl
27.96	SO ₂ CH ₃	Br
27.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
27.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
27.99	SO ₂ CH ₃	nC ₃ H ₇
27.100	SO ₂ CH ₃	iC ₃ H ₇
27.101	SO ₂ CH ₃	nC ₄ H ₉
27.102	SO ₂ CH ₃	tC ₄ H ₉
27.103	SO ₂ CH ₃	Ph
27.104	SO ₂ CH ₃	OH
27.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
27.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
27.107	SO ₂ CH ₃	O(nC ₃ H ₇)
27.108	SO ₂ CH ₃	O(iC ₃ H ₇)
27.109	SO ₂ CH ₃	O(nC ₄ H ₉)
27.110	SO ₂ CH ₃	O(tC ₄ H ₉)
27.111	SO ₂ CH ₃	OPh
27.112	SO ₂ CH ₃	SH
27.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
27.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
27.115	SO ₂ CH ₃	S(nC ₃ H ₇)
27.116	SO ₂ CH ₃	S(iC ₃ H ₇)
27.117	SO ₂ CH ₃	S(nC ₄ H ₉)
27.118	SO ₂ CH ₃	S(tC ₄ H ₉)
27.119	SO ₂ CH ₃	SPh
27.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
27.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
27.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
27.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
27.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
27.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

Nr.	R ¹	R ²
27.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
27.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
27.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
27.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
27.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
27.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
27.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
27.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
27.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
27.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
27.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
27.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
27.138	SO ₂ CH ₃	CN
27.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 5:



28

Nr.	R'	R''
28.1	Cl	F
28.2	Cl	Cl
28.3	Cl	Br
28.4	Cl	CH ₃
28.5	Cl	C ₂ H ₅
28.6	Cl	nC ₃ H ₇
28.7	Cl	iC ₃ H ₇
28.8	Cl	nC ₄ H ₉
28.9	Cl	tC ₄ H ₉
28.10	Cl	Ph
28.11	Cl	OH
28.12	Cl	OCH ₃
28.13	Cl	OC ₂ H ₅
28.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
28.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
28.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
28.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
28.18	Cl	OPh
28.19	Cl	SH
28.20	Cl	SCH ₃
28.21	Cl	SC ₂ H ₅
28.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
28.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
28.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
28.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

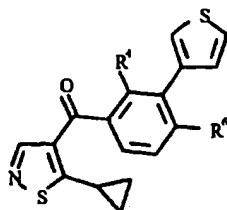
No.	R ¹	R ²
28.26	Cl	SPh
28.27	Cl	CCl ₃
28.28	Cl	CH ₂ F
28.29	Cl	CHF ₂
28.30	Cl	CF ₃
28.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
28.32	Cl	SO ₂ H
28.33	Cl	SO ₂ CH ₃
28.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
28.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
28.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
28.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
28.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
28.39	Cl	SO ₂ Ph
28.40	Cl	NH ₂
28.41	Cl	NHCH ₃
28.42	Cl	NCH ₃ Ph
28.43	Cl	N(CH ₃) ₂
28.44	Cl	NPh ₂
28.45	Cl	CN
28.46	Cl	NO ₂
28.47	CH ₃	F
28.48	CH ₃	Cl
28.49	CH ₃	Br
28.50	CH ₃	CH ₃
28.51	CH ₃	C ₂ H ₅
28.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
28.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
28.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
28.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
28.57	CH ₃	Ph

28.58	CH ₃	OH
28.59	CH ₃	OCH ₃
28.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
28.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
28.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
28.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
28.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
28.65	CH ₃	OPh
28.66	CH ₃	SH
28.67	CH ₃	SCH ₃
28.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
28.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
28.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
28.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
28.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
28.73	CH ₃	SPh
28.74	CH ₃	CCl ₃
28.75	CH ₃	CH ₂ F
28.76	CH ₃	CHF ₂
28.77	CH ₃	CF ₃
28.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
28.79	CH ₃	SO ₃ H
28.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
28.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
28.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
28.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
28.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
28.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
28.86	CH ₃	SO ₂ Ph
28.87	CH ₃	NH ₂
28.88	CH ₃	NHCH ₃
28.89	CH ₃	NCH ₃ Ph

28.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
28.91	CH ₃	NPh ₂
28.92	CH ₃	CN
28.93	CH ₃	NO ₂
28.94	SO ₂ CH ₃	F
28.95	SO ₂ CH ₃	Cl
28.96	SO ₂ CH ₃	Br
28.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
28.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
28.99	SO ₂ CH ₃	nC ₃ H ₇
28.100	SO ₂ CH ₃	iC ₃ H ₇
28.101	SO ₂ CH ₃	nC ₄ H ₉
28.102	SO ₂ CH ₃	iC ₄ H ₉
28.103	SO ₂ CH ₃	Ph
28.104	SO ₂ CH ₃	OH
28.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
28.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
28.107	SO ₂ CH ₃	O(nC ₃ H ₇)
28.108	SO ₂ CH ₃	O(iC ₃ H ₇)
28.109	SO ₂ CH ₃	O(nC ₄ H ₉)
28.110	SO ₂ CH ₃	O(iC ₄ H ₉)
28.111	SO ₂ CH ₃	OPh
28.112	SO ₂ CH ₃	SH
28.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
28.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
28.115	SO ₂ CH ₃	S(nC ₃ H ₇)
28.116	SO ₂ CH ₃	S(iC ₃ H ₇)
28.117	SO ₂ CH ₃	S(nC ₄ H ₉)
28.118	SO ₂ CH ₃	S(iC ₄ H ₉)
28.119	SO ₂ CH ₃	SPh
28.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
28.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
28.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂

28.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
28.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
28.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H
28.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
28.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
28.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
28.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
28.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
28.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
28.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
28.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
28.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
28.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
28.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
28.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
28.138	SO ₂ CH ₃	CN
28.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 6:



29

Nr.	R'	R''
29.1	Cl	F
29.2	Cl	Cl
29.3	Cl	Br
29.4	Cl	CH ₃
29.5	Cl	C ₂ H ₅
29.6	Cl	nC ₃ H ₇
29.7	Cl	iC ₃ H ₇
29.8	Cl	nC ₄ H ₉
29.9	Cl	tC ₄ H ₉
29.10	Cl	Ph
29.11	Cl	OH
29.12	Cl	OCH ₃
29.13	Cl	OC ₂ H ₅
29.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
29.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
29.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
29.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
29.18	Cl	OPh
29.19	Cl	SH
29.20	Cl	SCH ₃
29.21	Cl	SC ₂ H ₅
29.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
29.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
29.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
29.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

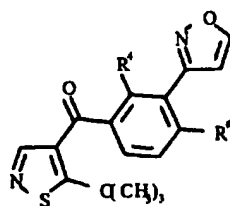
Ne	R ¹	R ²
29.26	Cl	SPh
29.27	Cl	CCl ₃
29.28	Cl	CH ₂ F
29.29	Cl	CHF ₂
29.30	Cl	CF ₃
29.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
29.32	Cl	SO ₃ H
29.33	Cl	SO ₂ CH ₃
29.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
29.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.39	Cl	SO ₂ Ph
29.40	Cl	NH ₂
29.41	Cl	NHCH ₃
29.42	Cl	NCH ₃ Ph
29.43	Cl	N(CH ₃) ₂
29.44	Cl	NPh ₂
29.45	Cl	CN
29.46	Cl	NO ₂
29.47	CH ₃	F
29.48	CH ₃	Cl
29.49	CH ₃	Br
29.50	CH ₃	CH ₃
29.51	CH ₃	C ₂ H ₅
29.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
29.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
29.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
29.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
29.57	CH ₃	Ph
29.58	CH ₃	OH
29.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ₁	R ₂
29.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
29.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.65	CH ₃	OPh
29.66	CH ₃	SH
29.67	CH ₃	SCH ₃
29.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
29.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.73	CH ₃	SPh
29.74	CH ₃	CCl ₃
29.75	CH ₃	CH ₂ F
29.76	CH ₃	CHF ₂
29.77	CH ₃	CF ₃
29.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
29.79	CH ₃	SO ₃ H
29.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
29.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
29.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.86	CH ₃	SO ₂ Ph
29.87	CH ₃	NH ₂
29.88	CH ₃	NHCH ₃
29.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
29.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
29.91	CH ₃	NPh ₂
29.92	CH ₃	CN

Nr.	R ¹	R ²
29.93	CH ₃	NO ₂
29.94	SO ₂ CH ₃	F
29.95	SO ₂ CH ₃	Cl
29.96	SO ₂ CH ₃	Br
29.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
29.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
29.99	SO ₂ CH ₃	nC ₃ H ₇
29.100	SO ₂ CH ₃	iC ₃ H ₇
29.101	SO ₂ CH ₃	nC ₄ H ₉
29.102	SO ₂ CH ₃	iC ₄ H ₉
29.103	SO ₂ CH ₃	Ph
29.104	SO ₂ CH ₃	OH
29.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
29.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
29.107	SO ₂ CH ₃	O(nC ₃ H ₇)
29.108	SO ₂ CH ₃	O(iC ₃ H ₇)
29.109	SO ₂ CH ₃	O(nC ₄ H ₉)
29.110	SO ₂ CH ₃	O(iC ₄ H ₉)
29.111	SO ₂ CH ₃	OPh
29.112	SO ₂ CH ₃	SH
29.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
29.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
29.115	SO ₂ CH ₃	S(nC ₃ H ₇)
29.116	SO ₂ CH ₃	S(iC ₃ H ₇)
29.117	SO ₂ CH ₃	S(nC ₄ H ₉)
29.118	SO ₂ CH ₃	S(iC ₄ H ₉)
29.119	SO ₂ CH ₃	SPh
29.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
29.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
29.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
29.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
29.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
29.125	SO ₂ CH ₃	SO ₂ H

Nr.	R ¹	R ²
29.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
29.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
29.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
29.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
29.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
29.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
29.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
29.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
29.138	SO ₂ CH ₃	CN
29.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 7:



30

Nr.	R'	R''
30.1	Cl	F
30.2	Cl	Cl
30.3	Cl	Br
30.4	Cl	CH ₃
30.5	Cl	C ₂ H ₅
30.6	Cl	nC ₃ H ₇
30.7	Cl	iC ₃ H ₇
30.8	Cl	nC ₄ H ₉
30.9	Cl	iC ₄ H ₉
30.10	Cl	Ph
30.11	Cl	OH
30.12	Cl	OCH ₃
30.13	Cl	OC ₂ H ₅
30.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
30.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
30.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
30.17	Cl	O(iC ₄ H ₉)
30.18	Cl	OPh
30.19	Cl	SH
30.20	Cl	SCH ₃
30.21	Cl	SC ₂ H ₅
30.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
30.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
30.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
30.25	Cl	S(iC ₄ H ₉)

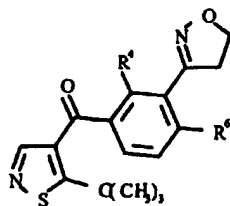
No.	R ¹	R ²
30.26	Cl	SPh
30.27	Cl	CCl ₃
30.28	Cl	CH ₂ F
30.29	Cl	CHF ₂
30.30	Cl	CF ₃
30.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
30.32	Cl	SO ₃ H
30.33	Cl	SO ₂ CH ₃
30.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
30.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.39	Cl	SO ₂ Ph
30.40	Cl	NH ₂
30.41	Cl	NHCH ₃
30.42	Cl	NCH ₃ Ph
30.43	Cl	N(CH ₃) ₂
30.44	Cl	NPh ₂
30.45	Cl	CN
30.46	Cl	NO ₂
30.47	CH ₃	F
30.48	CH ₃	Cl
30.49	CH ₃	Br
30.50	CH ₃	CH ₃
30.51	CH ₃	C ₂ H ₅
30.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
30.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
30.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
30.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
30.57	CH ₃	Ph
30.58	CH ₃	OH
30.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ₁	R ₂
30.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
30.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.65	CH ₃	OPh
30.66	CH ₃	SH
30.67	CH ₃	SCH ₃
30.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
30.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.73	CH ₃	SPh
30.74	CH ₃	CCl ₃
30.75	CH ₃	CH ₂ F
30.76	CH ₃	CHF ₂
30.77	CH ₃	CF ₃
30.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
30.79	CH ₃	SO ₃ H
30.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
30.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
30.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.86	CH ₃	SO ₂ Ph
30.87	CH ₃	NH ₂
30.88	CH ₃	NHCH ₃
30.89	CH ₃	NCH ₃ Ph

30.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
30.91	CH ₃	NPh ₂
30.92	CH ₃	CN
30.93	CH ₃	NO ₂
30.94	SO ₂ CH ₃	F
30.95	SO ₂ CH ₃	Cl
30.96	SO ₂ CH ₃	Br
30.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
30.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
30.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
30.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
30.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
30.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
30.103	SO ₂ CH ₃	Ph
30.104	SO ₂ CH ₃	OH
30.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
30.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
30.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.111	SO ₂ CH ₃	OPh
30.112	SO ₂ CH ₃	SH
30.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
30.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
30.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.119	SO ₂ CH ₃	SPh
30.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
30.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
30.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂

30.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
30.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
30.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H
30.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
30.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
30.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
30.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
30.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
30.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
30.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
30.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
30.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
30.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
30.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
30.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
30.138	SO ₂ CH ₃	CN
30.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 8:



31

Nr.	R^4	R^5
31.1	Cl	F
31.2	Cl	Cl
31.3	Cl	Br
31.4	Cl	CH_3
31.5	Cl	C_2H_5
31.6	Cl	nC_3H_7
31.7	Cl	iC_3H_7
31.8	Cl	nC_4H_9
31.9	Cl	tC_4H_9
31.10	Cl	Ph
31.11	Cl	OH
31.12	Cl	OCH_3
31.13	Cl	OC_2H_5
31.14	Cl	$O(nC_3H_7)$
31.15	Cl	$O(iC_3H_7)$
31.16	Cl	$O(nC_4H_9)$
31.17	Cl	$O(tC_4H_9)$
31.18	Cl	OPh
31.19	Cl	SH
31.20	Cl	SCH_3
31.21	Cl	SC_2H_5
31.22	Cl	$S(nC_3H_7)$
31.23	Cl	$S(iC_3H_7)$
31.24	Cl	$S(nC_4H_9)$
31.25	Cl	$S(tC_4H_9)$

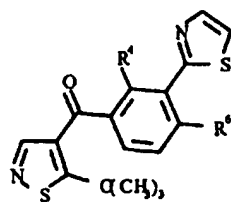
No.	R ¹	R ²
31.26	Cl	SPh
31.27	Cl	CCl ₃
31.28	Cl	CH ₂ F
31.29	Cl	CHF ₂
31.30	Cl	CF ₃
31.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
31.32	Cl	SO ₃ H
31.33	Cl	SO ₂ CH ₃
31.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
31.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.39	Cl	SO ₂ Ph
31.40	Cl	NH ₂
31.41	Cl	NHCH ₃
31.42	Cl	NCH ₃ Ph
31.43	Cl	N(CH ₃) ₂
31.44	Cl	NPh ₂
31.45	Cl	CN
31.46	Cl	NO ₂
31.47	CH ₃	F
31.48	CH ₃	Cl
31.49	CH ₃	Br
31.50	CH ₃	CH ₃
31.51	CH ₃	C ₂ H ₅
31.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
31.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
31.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
31.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
31.57	CH ₃	Ph
31.58	CH ₃	OH
31.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ^a	R ^b
31.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
31.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.65	CH ₃	OPh
31.66	CH ₃	SH
31.67	CH ₃	SCH ₃
31.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
31.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.73	CH ₃	SPh
31.74	CH ₃	CCl ₃
31.75	CH ₃	CH ₂ F
31.76	CH ₃	CHF ₂
31.77	CH ₃	CF ₃
31.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
31.79	CH ₃	SO ₃ H
31.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
31.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
31.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.86	CH ₃	SO ₂ Ph
31.87	CH ₃	NH ₂
31.88	CH ₃	NHCH ₃
31.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
31.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
31.91	CH ₃	NPh ₂
31.92	CH ₃	CN

Nr.	R	R'
31.93	CH ₃	NO ₂
31.94	SO ₂ CH ₃	F
31.95	SO ₂ CH ₃	Cl
31.96	SO ₂ CH ₃	Br
31.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
31.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
31.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
31.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
31.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
31.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
31.103	SO ₂ CH ₃	Ph
31.104	SO ₂ CH ₃	OH
31.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
31.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
31.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.111	SO ₂ CH ₃	OPh
31.112	SO ₂ CH ₃	SH
31.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
31.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
31.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
31.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
31.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
31.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
31.119	SO ₂ CH ₃	SPh
31.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
31.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
31.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
31.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
31.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
31.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

N ^o	R ^a	R ^b
31.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
31.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
31.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (nC ₃ H ₇)
31.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (iC ₃ H ₇)
31.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (nC ₄ H ₉)
31.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (tC ₄ H ₉)
31.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
31.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
31.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
31.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
31.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
31.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
31.138	SO ₂ CH ₃	CN
31.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 9:



Nr.	R'	R''
32.1	Cl	F
32.2	Cl	Cl
32.3	Cl	Br
32.4	Cl	CH ₃
32.5	Cl	C ₂ H ₅
32.6	Cl	nC ₃ H ₇
32.7	Cl	iC ₃ H ₇
32.8	Cl	nC ₄ H ₉
32.9	Cl	iC ₄ H ₉
32.10	Cl	Ph
32.11	Cl	OH
32.12	Cl	OCH ₃
32.13	Cl	OC ₂ H ₅
32.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
32.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
32.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
32.17	Cl	O(iC ₄ H ₉)
32.18	Cl	OPh
32.19	Cl	SH
32.20	Cl	SCH ₃
32.21	Cl	SC ₂ H ₅
32.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
32.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
32.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
32.25	Cl	S(iC ₄ H ₉)

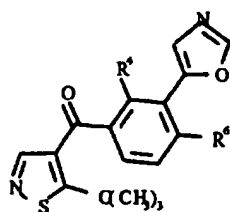
Nr.	R ¹	R ²
32.26	Cl	SPh
32.27	Cl	CCl ₃
32.28	Cl	CH ₂ F
32.29	Cl	CHF ₂
32.30	Cl	CF ₃
32.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
32.32	Cl	SO ₂ H
32.33	Cl	SO ₂ CH ₃
32.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
32.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.39	Cl	SO ₂ Ph
32.40	Cl	NH ₂
32.41	Cl	NHCH ₃
32.42	Cl	NCH ₃ Ph
32.43	Cl	N(CH ₃) ₂
32.44	Cl	NPh ₂
32.45	Cl	CN
32.46	Cl	NO ₂
32.47	CH ₃	F
32.48	CH ₃	Cl
32.49	CH ₃	Br
32.50	CH ₃	CH ₃
32.51	CH ₃	C ₂ H ₅
32.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
32.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
32.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
32.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
32.57	CH ₃	Ph

No.	R ₁	R ₂
32.58	CH ₃	OH
32.59	CH ₃	OCH ₃
32.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
32.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.65	CH ₃	OPh
32.66	CH ₃	SH
32.67	CH ₃	SCH ₃
32.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
32.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.73	CH ₃	SPh
32.74	CH ₃	CCl ₃
32.75	CH ₃	CH ₂ F
32.76	CH ₃	CHF ₂
32.77	CH ₃	CF ₃
32.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
32.79	CH ₃	SO ₃ H
32.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
32.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
32.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.86	CH ₃	SO ₂ Ph
32.87	CH ₃	NH ₂
32.88	CH ₃	NHCH ₃
32.89	CH ₃	NCH ₃ Ph

Nr.	R ¹	R ²
32.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
32.91	CH ₃	NPh ₂
32.92	CH ₃	CN
32.93	CH ₃	NO ₂
32.94	SO ₂ CH ₃	F
32.95	SO ₂ CH ₃	Cl
32.96	SO ₂ CH ₃	Br
32.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
32.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
32.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
32.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
32.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
32.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
32.103	SO ₂ CH ₃	Ph
32.104	SO ₂ CH ₃	OH
32.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
32.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
32.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.111	SO ₂ CH ₃	OPh
32.112	SO ₂ CH ₃	SH
32.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
32.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
32.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.119	SO ₂ CH ₃	SPh
32.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
32.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
32.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂

No.	R ¹	R ²
32.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
32.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
32.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H
32.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
32.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
32.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
32.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
32.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
32.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
32.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
32.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
32.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
32.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
32.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
32.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
32.138	SO ₂ CH ₃	CN
32.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 10:



33

Nr.	R'	R''
33.1	Cl	F
33.2	Cl	Cl
33.3	Cl	Br
33.4	Cl	CH ₃
33.5	Cl	C ₂ H ₅
33.6	Cl	<i>n</i> C ₃ H ₇
33.7	Cl	<i>i</i> C ₃ H ₇
33.8	Cl	<i>n</i> C ₄ H ₉
33.9	Cl	<i>t</i> C ₄ H ₉
33.10	Cl	Ph
33.11	Cl	OH
33.12	Cl	OCH ₃
33.13	Cl	OC ₂ H ₅
33.14	Cl	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.15	Cl	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.16	Cl	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.17	Cl	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.18	Cl	OPh
33.19	Cl	SH
33.20	Cl	SCH ₃
33.21	Cl	SC ₂ H ₅
33.22	Cl	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.23	Cl	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.24	Cl	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.25	Cl	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)

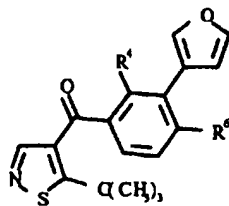
Nr.	R ¹	R ²
33.26	Cl	SPh
33.27	Cl	CCl ₃
33.28	Cl	CH ₂ F
33.29	Cl	CHF ₂
33.30	Cl	CF ₃
33.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
33.32	Cl	SO ₃ H
33.33	Cl	SO ₂ CH ₃
33.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
33.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.39	Cl	SO ₂ Ph
33.40	Cl	NH ₂
33.41	Cl	NHCH ₃
33.42	Cl	NCH ₃ Ph
33.43	Cl	N(CH ₃) ₂
33.44	Cl	NPh ₂
33.45	Cl	CN
33.46	Cl	NO ₂
33.47	CH ₃	F
33.48	CH ₃	Cl
33.49	CH ₃	Br
33.50	CH ₃	CH ₃
33.51	CH ₃	C ₂ H ₅
33.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
33.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
33.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
33.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
33.57	CH ₃	Ph
33.58	CH ₃	OH
33.59	CH ₃	OCH ₃

Nr.	R ¹	R ²
33.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
33.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.65	CH ₃	OPh
33.66	CH ₃	SH
33.67	CH ₃	SCH ₃
33.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
33.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.73	CH ₃	SPh
33.74	CH ₃	CCl ₃
33.75	CH ₃	CH ₂ F
33.76	CH ₃	CHF ₂
33.77	CH ₃	CF ₃
33.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
33.79	CH ₃	SO ₃ H
33.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
33.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
33.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.86	CH ₃	SO ₂ Ph
33.87	CH ₃	NH ₂
33.88	CH ₃	NHCH ₃
33.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
33.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
33.91	CH ₃	NPh ₂
33.92	CH ₃	CN

No.	R ¹	R ²
33.93	CH ₃	NO ₂
33.94	SO ₂ CH ₃	F
33.95	SO ₂ CH ₃	Cl
33.96	SO ₂ CH ₃	Br
33.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
33.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
33.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
33.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
33.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
33.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
33.103	SO ₂ CH ₃	Ph
33.104	SO ₂ CH ₃	OH
33.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
33.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
33.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.111	SO ₂ CH ₃	OPh
33.112	SO ₂ CH ₃	SH
33.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
33.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
33.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.119	SO ₂ CH ₃	SPh
33.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
33.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
33.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
33.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
33.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
33.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

Nr.	R ^a	R ^b
33.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
33.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
33.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
33.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
33.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
33.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
33.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
33.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
33.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
33.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
33.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
33.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
33.138	SO ₂ CH ₃	CN
33.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 11:



34

Nr.	R^1	R^2
34.1	Cl	F
34.2	Cl	Cl
34.3	Cl	Br
34.4	Cl	CH_3
34.5	Cl	C_2H_5
34.6	Cl	$n\text{C}_3\text{H}_7$
34.7	Cl	$i\text{C}_3\text{H}_7$
34.8	Cl	$n\text{C}_4\text{H}_9$
34.9	Cl	$t\text{C}_4\text{H}_9$
34.10	Cl	Ph
34.11	Cl	OH
34.12	Cl	OCH_3
34.13	Cl	OC_2H_5
34.14	Cl	$\text{O}(n\text{C}_3\text{H}_7)$
34.15	Cl	$\text{O}(i\text{C}_3\text{H}_7)$
34.16	Cl	$\text{O}(n\text{C}_4\text{H}_9)$
34.17	Cl	$\text{O}(t\text{C}_4\text{H}_9)$
34.18	Cl	OPh
34.19	Cl	SH
34.20	Cl	SCH_3
34.21	Cl	SC_2H_5
34.22	Cl	$\text{S}(n\text{C}_3\text{H}_7)$
34.23	Cl	$\text{S}(i\text{C}_3\text{H}_7)$
34.24	Cl	$\text{S}(n\text{C}_4\text{H}_9)$
34.25	Cl	$\text{S}(t\text{C}_4\text{H}_9)$

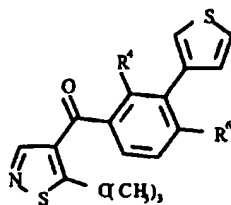
Nr	R ¹	R ²
34.26	Cl	SPh
34.27	Cl	CCl ₃
34.28	Cl	CH ₂ F
34.29	Cl	CHF ₂
34.30	Cl	CF ₃
34.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
34.32	Cl	SO ₃ H
34.33	Cl	SO ₂ CH ₃
34.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
34.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.39	Cl	SO ₂ Ph
34.40	Cl	NH ₂
34.41	Cl	NHCH ₃
34.42	Cl	NCH ₃ Ph
34.43	Cl	N(CH ₃) ₂
34.44	Cl	NPh ₂
34.45	Cl	CN
34.46	Cl	NO ₂
34.47	CH ₃	F
34.48	CH ₃	Cl
34.49	CH ₃	Br
34.50	CH ₃	CH ₃
34.51	CH ₃	C ₂ H ₅
34.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
34.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
34.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
34.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
34.57	CH ₃	Ph
34.58	CH ₃	OH
34.59	CH ₃	OCH ₃

No.	R ¹	R ²
34.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
34.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.65	CH ₃	OPh
34.66	CH ₃	SH
34.67	CH ₃	SCH ₃
34.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
34.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.73	CH ₃	SPh
34.74	CH ₃	CCl ₃
34.75	CH ₃	CH ₂ F
34.76	CH ₃	CHF ₂
34.77	CH ₃	CF ₃
34.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
34.79	CH ₃	SO ₂ H
34.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
34.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
34.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.86	CH ₃	SO ₂ Ph
34.87	CH ₃	NH ₂
34.88	CH ₃	NHCH ₃
34.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
34.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
34.91	CH ₃	NPh ₂
34.92	CH ₃	CN

Nr.	R ^a	R ^b
34.93	CH ₃	NO ₂
34.94	SO ₂ CH ₃	F
34.95	SO ₂ CH ₃	Cl
34.96	SO ₂ CH ₃	Br
34.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
34.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
34.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
34.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
34.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
34.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
34.103	SO ₂ CH ₃	Ph
34.104	SO ₂ CH ₃	OH
34.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
34.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
34.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.111	SO ₂ CH ₃	OPh
34.112	SO ₂ CH ₃	SH
34.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
34.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
34.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.119	SO ₂ CH ₃	SPh
34.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
34.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
34.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
34.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
34.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
34.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

Nr.	R ¹	R ²
34.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
34.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
34.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
34.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
34.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
34.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
34.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
34.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
34.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
34.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
34.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
34.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
34.138	SO ₂ CH ₃	CN
34.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 12:



35

Nr.	R'	R''
35.1	Cl	F
35.2	Cl	Cl
35.3	Cl	Br
35.4	Cl	CH ₃
35.5	Cl	C ₂ H ₅
35.6	Cl	nC ₃ H ₇
35.7	Cl	iC ₃ H ₇
35.8	Cl	nC ₄ H ₉
35.9	Cl	tC ₄ H ₉
35.10	Cl	Ph
35.11	Cl	OH
35.12	Cl	OCH ₃
35.13	Cl	OC ₂ H ₅
35.14	Cl	O(nC ₃ H ₇)
35.15	Cl	O(iC ₃ H ₇)
35.16	Cl	O(nC ₄ H ₉)
35.17	Cl	O(tC ₄ H ₉)
35.18	Cl	OPh
35.19	Cl	SH
35.20	Cl	SCH ₃
35.21	Cl	SC ₂ H ₅
35.22	Cl	S(nC ₃ H ₇)
35.23	Cl	S(iC ₃ H ₇)
35.24	Cl	S(nC ₄ H ₉)
35.25	Cl	S(tC ₄ H ₉)

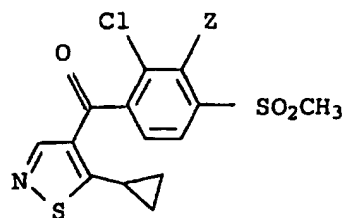
No.	R ¹	R ²
35.26	Cl	SPh
35.27	Cl	CCl ₃
35.28	Cl	CH ₂ F
35.29	Cl	CHF ₂
35.30	Cl	CF ₃
35.31	Cl	CF ₂ CHF ₂
35.32	Cl	SO ₃ H
35.33	Cl	SO ₂ CH ₃
35.34	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅
35.35	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.36	Cl	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.37	Cl	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.38	Cl	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.39	Cl	SO ₂ Ph
35.40	Cl	NH ₂
35.41	Cl	NHCH ₃
35.42	Cl	NCH ₃ Ph
35.43	Cl	N(CH ₃) ₂
35.44	Cl	NPh ₂
35.45	Cl	CN
35.46	Cl	NO ₂
35.47	CH ₃	F
35.48	CH ₃	Cl
35.49	CH ₃	Br
35.50	CH ₃	CH ₃
35.51	CH ₃	C ₂ H ₅
35.53	CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
35.54	CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
35.55	CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
35.56	CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
35.57	CH ₃	Ph
35.58	CH ₃	OH
35.59	CH ₃	OCH ₃

№	R ⁺	R ⁺
35.60	CH ₃	OC ₂ H ₅
35.61	CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.62	CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.63	CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.64	CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.65	CH ₃	OPh
35.66	CH ₃	SH
35.67	CH ₃	SCH ₃
35.68	CH ₃	SC ₂ H ₅
35.69	CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.70	CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.71	CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.72	CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.73	CH ₃	SPh
35.74	CH ₃	CCl ₃
35.75	CH ₃	CH ₂ F
35.76	CH ₃	CHF ₂
35.77	CH ₃	CF ₃
35.78	CH ₃	CF ₂ CHF ₂
35.79	CH ₃	SO ₃ H
35.80	CH ₃	SO ₂ CH ₃
35.81	CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
35.82	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.83	CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.84	CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.85	CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.86	CH ₃	SO ₂ Ph
35.87	CH ₃	NH ₂
35.88	CH ₃	NHCH ₃
35.89	CH ₃	NCH ₃ Ph
35.90	CH ₃	N(CH ₃) ₂
35.91	CH ₃	NPh ₂
35.92	CH ₃	CN

Nr	R ¹	R ²
35.93	CH ₃	NO ₂
35.94	SO ₂ CH ₃	F
35.95	SO ₂ CH ₃	Cl
35.96	SO ₂ CH ₃	Br
35.97	SO ₂ CH ₃	CH ₃
35.98	SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
35.99	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₃ H ₇
35.100	SO ₂ CH ₃	<i>i</i> C ₃ H ₇
35.101	SO ₂ CH ₃	<i>n</i> C ₄ H ₉
35.102	SO ₂ CH ₃	<i>t</i> C ₄ H ₉
35.103	SO ₂ CH ₃	Ph
35.104	SO ₂ CH ₃	OH
35.105	SO ₂ CH ₃	OCH ₃
35.106	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅
35.107	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.108	SO ₂ CH ₃	O(<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.109	SO ₂ CH ₃	O(<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.110	SO ₂ CH ₃	O(<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.111	SO ₂ CH ₃	OPh
35.112	SO ₂ CH ₃	SH
35.113	SO ₂ CH ₃	SCH ₃
35.114	SO ₂ CH ₃	SC ₂ H ₅
29.115	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₃ H ₇)
29.116	SO ₂ CH ₃	S(<i>i</i> C ₃ H ₇)
29.117	SO ₂ CH ₃	S(<i>n</i> C ₄ H ₉)
29.118	SO ₂ CH ₃	S(<i>t</i> C ₄ H ₉)
29.119	SO ₂ CH ₃	SPh
29.120	SO ₂ CH ₃	CCl ₃
35.121	SO ₂ CH ₃	CH ₂ F
35.122	SO ₂ CH ₃	CHF ₂
35.123	SO ₂ CH ₃	CF ₃
35.124	SO ₂ CH ₃	CF ₂ CHF ₂
35.125	SO ₂ CH ₃	SO ₃ H

Nr.	R ^a	R ^b
35.126	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
35.127	SO ₂ CH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅
35.128	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₃ H ₇)
35.129	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>i</i> C ₃ H ₇)
35.130	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>n</i> C ₄ H ₉)
35.131	SO ₂ CH ₃	SO ₂ (<i>t</i> C ₄ H ₉)
35.132	SO ₂ CH ₃	SO ₂ Ph
35.133	SO ₂ CH ₃	NH ₂
35.134	SO ₂ CH ₃	NHCH ₃
35.135	SO ₂ CH ₃	NCH ₃ Ph
35.136	SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
35.137	SO ₂ CH ₃	NPh ₂
35.138	SO ₂ CH ₃	CN
35.139	SO ₂ CH ₃	NO ₂

Tabelle 13:



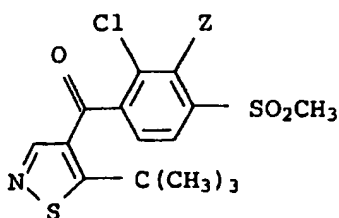
36

36.1	2-Thienyl
36.2	2-Furyl
36.3	3-Methyl-isoxazol-5-yl
36.4	5-Thiazolyl
36.5	4-Thiazolyl
36.6	3-Methyl-isothiazol-5-yl
36.7	5-Phenyl-thiazol-2-yl
36.8	2-Pyridyl
36.9	3-Pyridyl
36.10	4-Pyridyl
36.11	1-Methyl-2-pyrrolyl
36.12	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
36.13	2-Benzthiazolyl
36.14	2-Chinoliny
36.15	1-Methylbenzimidazol-2-yl
36.16	2-Oxazolyl
36.17	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
36.18	1-Methyl-pyrazol-3-yl
36.19	1-Methyl-pyrazol-5-yl
36.20	1,3-Dimethylpyrazol-3-yl
36.21	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
36.22	1,4-Dimethylpyrazol-5-yl
36.23	1,3-Dimethylpyrazol-4-yl
36.24	1,5-Dimethylpyrazol-4-yl
36.25	1-Methyl-pyrazol-4-yl
36.26	1,3-Dimethylpyrazol-5-yl
36.27	4-Methyl-oxazol-2-yl
36.28	5-Methylthio-thiazol-2-yl
36.29	4-Methoxy-1-methylpyrazol-5-yl

Nr.	2
36.30	3-Cyclopropylisoxazol-5-yl
36.31	3-Isopropylisoxazol-5-yl
36.32	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
36.33	5-Methyl-thiazol-2-yl
36.34	4-Brom-2-thienyl
36.35	5-Methyl-2-thienyl
36.36	4-Methyl-2-thienyl
36.37	4-Methyl-thiazol-2-yl
36.38	4-Chlor-thiazol-2-yl
36.39	4,5-Dimethylthiazol-2-yl
36.40	4-Phenyl-thiazol-2-yl
36.41	2-Methoxy-thiazol-5-yl
36.42	4-Methyl-2-pyridyl
36.43	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
36.44	6-Methylthio-2-pyridyl
36.45	6-Methoxy-3-pyridyl
36.46	6-Methoxy-2-pyridyl
36.47	6-Methyl-2-pyridyl
36.48	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
36.49	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
36.50	5-Pyrimidinyl
36.51	6-Dimethylamino-3-pyridyl
36.52	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
36.53	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
36.54	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
36.55	2-Pyrimidinyl
36.56	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
36.57	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
36.58	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
36.59	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
36.60	5-Methyl-oxazol-2-yl
36.61	5-Phenyl-oxazol-2-yl
36.62	2-Methyl-oxazol-5-yl
36.63	2-Phenyl-oxazol-5-yl
36.64	2-Methyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
36.65	2-Phenyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
36.66	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
36.67	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl

Nr.	
36.68	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
36.69	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
36.70	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
36.71	5-Cyano-4,5-dihydro-isoxazol-3-yl
36.72	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
36.73	1,3-Dithiolan-2-yl
36.74	1,3-Dioxolan-2-yl
36.75	1,3-Dithian-2-yl
36.76	1,3-Dioxan-2-yl
36.77	1,3-Oxathiolan-2-yl
36.78	1,2,4-Triazol-1-yl
36.79	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
36.80	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
36.81	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
36.82	3-Oxo-3-H-1,2,4-dithiazol-5-yl
36.83	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl

Tabelle 14:



36

Nr	Z
37.1	2-Thienyl
37.2	2-Furyl
37.3	3-Methyl-isoxazol-5-yl
37.4	5-Thiazolyl
37.5	4-Thiazolyl
37.6	3-Methyl-isothiazol-5-yl
37.7	5-Phenyl-thiazol-2-yl
37.8	2-Pyridyl
37.9	3-Pyridyl
37.10	4-Pyridyl
37.11	1-Methyl-2-pyrrolyl
37.12	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
37.13	2-Benzthiazolyl
37.14	2-Chinolinyl
37.15	1-Methylbenzimidazol-2-yl
37.16	2-Oxazolyl
37.17	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
37.18	1-Methyl-pyrazol-3-yl
37.19	1-Methyl-pyrazol-5-yl
37.20	1,3-Dimethylpyrazol-3-yl
37.21	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
37.22	1,4-Dimethylpyrazol-5-yl
37.23	1,3-Dimethylpyrazol-4-yl
37.24	1,5-Dimethylpyrazol-4-yl
37.25	1-Methyl-pyrazol-4-yl
37.26	1,3-Dimethylpyrazol-5-yl
37.27	4-Methyl-oxazol-2-yl
37.28	5-Methylthio-thiazol-2-yl
37.29	4-Methoxy-1-methylpyrazol-5-yl

No.	
37.30	3-Cyclopropylisoxazol-5-yl
37.31	3-Isopropylisoxazol-5-yl
37.32	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
37.33	5-Methyl-thiazol-2-yl
37.34	4-Brom-2-thienyl
37.35	5-Methyl-2-thienyl
37.36	4-Methyl-2-thienyl
37.37	4-Methyl-thiazol-2-yl
37.38	4-Chlor-thiazol-2-yl
37.39	4,5-Dimethylthiazol-2-yl
37.40	4-Phenyl-thiazol-2-yl
37.41	2-Methoxy-thiazol-5-yl
37.42	4-Methyl-2-pyridyl
37.43	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
37.44	6-Methylthio-2-pyridyl
37.45	6-Methoxy-3-pyridyl
37.46	6-Methoxy-2-pyridyl
37.47	6-Methyl-2-pyridyl
37.48	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
37.49	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
37.50	5-Pyrimidinyl
37.51	6-Dimethylamino-3-pyridyl
37.52	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
37.53	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
37.54	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
37.55	2-Pyrimidinyl
37.56	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
37.57	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
37.58	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
37.59	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
37.60	5-Methyl-oxazol-2-yl
37.61	5-Phenyl-oxazol-2-yl
37.62	2-Methyl-oxazol-5-yl
37.63	2-Phenyl-oxazol-5-yl
37.64	2-Methyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
37.65	2-Phenyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
37.66	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
37.67	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl

Nr.	Z
37.68	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
37.69	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
37.70	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
37.71	5-Cyano-4,5-dihydro-isoxazol-3-yl
37.72	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
37.73	1,3-Dithiolan-2-yl
37.74	1,3-Dioxolan-2yl
37.75	1,3-Dithian-2-yl
37.76	1,3-Dioxan-2-yl
37.77	1,3-Oxathiolan-2-yl
37.78	1,2,4-Triazol-1yl
37.79	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
37.80	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
37.81	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
37.82	3-Oxo-3-H-1,2,4-dithiazol-5-yl
37.83	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schädgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

10

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende

15 Kulturen:

- Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N. rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera, Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit

nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

- 5 Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granula-
- 10 ten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 15 Als inerte Zusatzstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin,
- 20 alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, z. B. Amine wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser.
- 25 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst,
- 30 mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.
- 35 Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-,
- 40 Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poly-
- 45 oxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethyleno-

xid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

5

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 10 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und
- 15 Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

20

Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew. %, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew. %, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden

25 dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäße Verbindung 24.33 kann beispielsweise wie folgt formuliert werden:

30

- I. 20 Gewichtsteile der Verbindung 24.33 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid,
- 35 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.
- 40
- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung 24.33 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid und 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von
- 45 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ein-

gießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

- 5 III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs 24.33 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch
10 Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs 24.33 werden mit 3
15 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der
20 Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew. % des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs 24.33 werden mit 97
Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält
25 auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew. % des Wirkstoffs enthält.
- VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs 24.33 werden mit 2
Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8
30 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
35
- VII. 1 Gewichtsteil der Verbindung 24.33 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20
Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10
Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält
40 ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- VIII. 1 Gewichtsteil der Verbindung 24.33 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20
Gewichtsteilen Emulphor EL (ethoxyliertes Rizinusöl/castoröl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
45

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die heterocyclisch substituierten Benzoylisothiazole I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, (Het)-Aryloxyalkansäure und deren Derivate, Benzoessäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, Hetaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, Meta-CF₃-phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- oder Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylelessigsäure und deren Derivate, Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide, Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a. S.)

Synthesebeispiele

Beispiel 1:

40

Synthese des 4-[2'-Chlor-3'-(isoxazol-3''-yl)-4'-sulfonylmethylbenzoyl]-5-cyclopropylisothiazols 24.33

Die folgenden Operationen werden unter Ausschluß von Feuchtigkeit durchgeführt. Zu 60 ml einer 1,4 M Lösung aus (0,08 mol) Methylmagnesiumbromid in Toluol/Tetrahydrofuran 3:1 (v/v) werden 9,0 g (0,04 mol) 4-Iod-5-cyclopropylisothiazol in 200 ml Tetrahydro-

107

furan unter Eiskühlung so zugegeben, daß die Reaktionstemperatur 5°C nicht übersteigt. Man versetzt das Reaktionsgemisch mit einer Lösung aus 25,6 g (0,08 mol) 2-Chlor-3-(isoxazol-3'-yl)-4-sulfonylmethylbenzoylchlorid in 300 ml Tetrahydrofuran. Nach Abkühlung der exothermen Reaktion werden Reste metallorganischer Verbindungen mit 100 ml 10%iger Salzsäure hydrolysiert. Das Reaktionsgemisch wird in Diethylether aufgenommen, wäßrig aufgearbeitet, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird an 250 g Kieselgel mit Gemischen aus Cyclohexan/Ethylacetat 10:1 bis 4:1 (v/v) gereinigt. Ausb. 4,6 g (28 %) farbloser, amorpher Feststoff, 270 MHz ¹H-NMR (CDCl₃), δ [ppm]: 1.0 (m, 2 H), 1.4 (m, 2 H), 3.0 (m, 1 H), 3.3 (s, 3 H), 6.6 (s, 1 H), 7.3 (d, 1 H), 8.2 (s, 1 H), 8.6 (s, 1 H)

15

Unter Verwendung der in Beispiel 1 beschriebenen Arbeitsvorschrift sind in entsprechender Weise die in Beispiel 2 und 3 beschriebenen Wirkstoffe der allgemeinen Formel 1 durch Reaktion der Isothiazolhalogenverbindungen der allgemeinen Formel 3 mit Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel 4 dargestellt worden.

Beispiel 2:

4-[2'-Chlor-3'-(4'',5''-dihydroisoxazol-3''-yl)-4'-sulfonylmethylbenzoyl]-5-cyclopropylisothiazol 25.33

270 MHz ¹H-NMR (CDCl₃), δ [ppm]: 3.2 (s, 3 H), 3.3 (m, 2 H), 4.6 (m, 2 H), 7.2 (m, 5 H), 7.4 (d, 1 H), 7.9 (d, 1 H), 8.9 (s, 1 H)

30

Beispiel 3:

4-[2'-Chlor-3'-(thiazol-2''-yl)-4'-sulfonylmethylbenzoyl]-5-cyclopropylisothiazol 26.33

35

270 MHz ¹H-NMR (CDCl₃), δ [ppm]: 1.0 (m, 2 H), 1.4 (m, 2 H), 3.0 (m, 1 H), 3.3 (s, 3 H), 7.7 (m, 2 H), 8.0 (m, 1 H), 8.3 (d, 1 H), 8.4 (s, 1 H)

40

45

Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der heterocyclisch substituierten Benzoyl-isothiazole der Formel 24.33 ließ sich durch Gewächshausversuche
5 zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0% Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

10

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilernder Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

20 Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung werden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen werden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder
25 sie werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.

Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung 0,5 bzw. 0,25 kg/ha a.S.

30

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.
35 tet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler
40 Wachstumsverlauf.

45

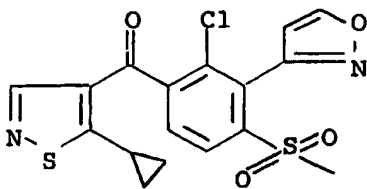
Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	<u>Lateinischer Name</u>	<u>Deutscher Name</u>	<u>Englischer Name</u>
5	Triticum aestivum	Winterweizen	winter wheat
	Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	Chenopodium album	Weißer Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)
10	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
	Sinapis album	Weißer Senf	white mustard
	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade

15

Tabelle 15 - Selektive herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

20



25

24.33

	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,5	0,25
30		Schädigung in %	
	Testpflanzen		
	TRZAW	0	0
	ABUTH	90	80
35	CHEAL	95	95
	SINAL	80	80
	SOLNI	95	90

40

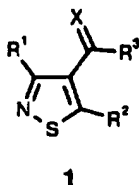
45

Patentansprüche

1. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1

5

10



in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

15

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; ggf. subst.
Alkoxycarbonyl;

20

ggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf.
subst. Hetaryl;R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder
Cycloalkenyl, wobei diese Reste einen oder mehrere der
folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Alkyl,
Alkenyl oder Alkynyl;
Aryl, wobei dieser Rest einen oder mehrere der folgen-
den Gruppen tragen kann:

25

Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyl-
oxy, Alkylthio oder Alkenylthio, wobei diese Reste par-
tiell oder vollständig halogeniert sein können oder
einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen können:
Alkoxy, Alkenyloxy, Aryloxy, Alkylsulfonyl, Alkenylsul-
fonyl oder Arylsulfonyl;

30

Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl;
ggf. subst. Aryloxy oder ggf. subst. Arylthio;
ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst.
Mono- oder Diarylamino oder ggf. subst. N-Alkyl-N-ary-
lamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden
sein können;
Halogen, Cyano oder Nitro;

35

40

45

111

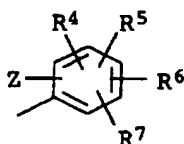
Hetaryl oder Heterocyclyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder einen oder mehrere der folgenden Gruppen tragen können:

5 Alkyl, Alkoxy oder Aryl und wobei im Fall von Heterocyclyl mindestens einer der Stickstoffe eine der folgenden Gruppen tragen kann:

10 Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Haloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Cycloalkyloxy, Haloalkoxy, ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Aryloxy;

R³ ein Rest der allgemeinen Formel 2

15



20

2

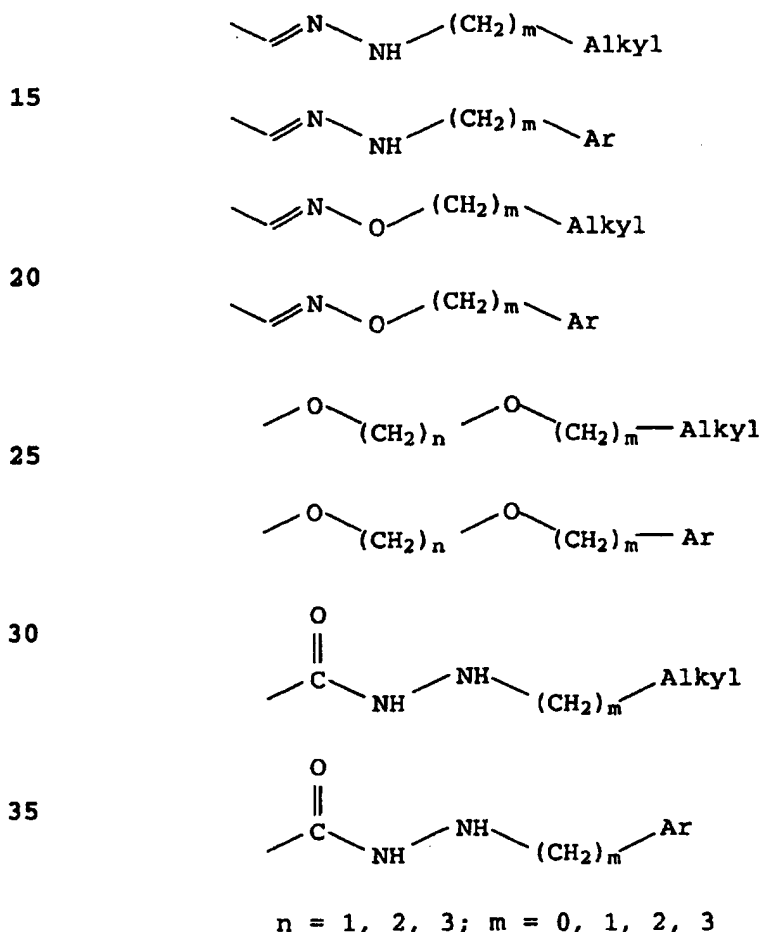
in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

25 Z 5- oder 6-gliedrige heterocyclische, gesättigte oder ungesättigte Reste, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, Alkyl, Halonalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Haloalkylthio, Di-alkylamino oder gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl oder Haloalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl oder Haloalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Di-alkylamino, Alkoxy, Haloalkoxy, oder Haloalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet,

45 R⁴-R⁷ können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkenyl, Cycloalkylalkinyl, Aryl, Arylalkyl, Arylalkenyl, Arylalkinyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Cycloalkoxy, Cycloalkylalkoxy, Cycloalky-

lalkenyloxy, Cycloalkylalkinyloxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Arylalkoxy, Arylalkenyloxy, Arylalkinyloxy, Thio, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkylalkylthio, Cycloalkylalkenylthio, Cycloalkylalkinylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Arylalkylthio, Arylalkenylthio, Arylalkinylthio, Amino, ggf. subst. Mono- oder Dialkylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, Cycloalkenylamino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkenylsulfonyl, Alkinylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl, Cycloalkylalkylsulfonyl, Cycloalkylalkenylsulfonyl, Cycloalkylalkinylsulfonyl, Arylsulfonyl, Arylalkylsulfonyl, Arylalkenylsulfonyl, Arylalkinylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Alkenylsulfoxyl, Alkinylsulfoxyl, Cycloalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkylsulfoxyl, Cycloalkylalkenylsulfoxyl, Cycloalkylalkinylsulfoxyl, Arylsulfoxyl, Arylalkylsulfoxyl, Arylalkenylsulfoxyl, Arylalkinylsulfoxyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminosulfonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylaminosulfonyl, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylaminosulfonyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Cycloalkylalkenylcarbonyl, Cycloalkylalkinylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl, Arylalkenylcarbonyl, Arylalkinylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxy carbonyl, Alkinyloxy carbonyl, Cycloalkoxy carbonyl, Cycloalkylalkoxy carbonyl, Cycloalkylalkenyloxy carbonyl, Cycloalkylalkinyloxy carbonyl, Aryloxy carbonyl, Arylalkoxy carbonyl, Arylalkenyloxy carbonyl, Arylalkinyloxy carbonyl, Aminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylaminocarbonyl, ggf. subst. Mono- oder Diarylamino carbonyl, ggf. subst. Mono- oder Dialkylcarbonylamino, ggf. subst. Mono- oder Diarylcarbonylamino, ggf. subst. N-Alkyl-N-arylcarbonylamino, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein können, Alkoxyaminocarbonyl, Alkenyloxy carbonylamino, Alkinyloxy carbonylamino, Cycloalkoxy carbonylamino, Cycloalkylalkoxy carbonylamino, Cycloalkylalkenyloxy carbonylamino, Cycloalkylalkinyloxy carbonylamino, Aryloxy carbonylamino, Arylalkoxy carbonylamino, Arylalkenyloxy carbonylamino, Arylalkinyloxy carbonylamino, Halogen, Haloalkyl, Haloalkenyl, Haloalkinyl, Haloalkoxy, Haloalkenyloxy, Haloalkinyloxy, Haloalkylthio, Haloalkenylthio, Haloal-

kinylthio, Haloalkylamino, Haloalkenylamino, Haloalki-
 nylamino, Haloalkylsulfonyl, Haloalkenylsulfonyl, Halo-
 alkinylsulfonyl, Haloalkylsulfoxyl, Haloalkenylsulfo-
 xyl, Haloalkinylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalke-
 nylcarbonyl, Haloalkinylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl,
 Haloalkenyloxycarbonyl, Haloalkinyloxycarbonyl, Haloal-
 kylaminocarbonyl, Haloalkenylaminocarbonyl, Haloalkiny-
 laminocarbonyl, Haloalkoxycarbonylamino, Haloalkenylo-
 xycarbonylamino, Haloalkinyloxycarbonylamino, Cyano
 oder Nitro oder ein der folgenden Gruppen:



40

R^4, R^5 können gemeinsam eine fünf- oder sechsgliedrige, gesät-
 tigte oder ungesättigte, aromatische oder nicht aroma-
 tische, ggf. subst. Alkylen-, Alkenylen- oder Alkdieny-
 lenkette bilden;

45

R^8 Alkyl, Haloalkyl, Alkoxy, oder NR^9R^{10} ,

114

R⁹ Wasserstoff oder Alkyl,
 R¹⁰ Alkyl,

5 sowie landwirtschaftlich übliche Salze der 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1.

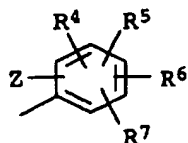
2. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach Anspruch 1, in der X Sauerstoff bedeutet.

10 3. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach Anspruch 1 oder 2, in der R¹ Wasserstoff oder ggf. subst. Alkoxycarbonyl bedeutet.

15 4. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 3, in der R² Alkyl, Cycloalkyl, Aryl, das einfach oder mehrfach durch Halogen oder Haloalkyl substituiert sein kann, oder Hetaryl, das einfach oder mehrfach durch Halogen substituiert sein kann.

20 5. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der R³ Methyl, Ethyl, Isopropyl, tert. Butyl, Cyclopropyl, 1-Methylcyclopropyl, 3-Trifluormethylphenyl, 2,4-Difluorphenyl, 1,3-Benzodioxolyl, 2,2-Difluor-1,3-benzodioxolyl, 1,3-Benzoxathiolyl,
 25 3,3-Dioxo-1,3-Benzoxathiolyl, Benzoxazolyl, Pyrazolyl oder Thienyl bedeutet.

30 6. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2



2

40 steht, in der Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat und die Substituenten R⁴-R⁷ die folgende Bedeutung haben:

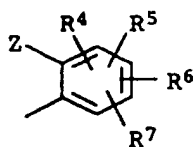
45 R⁴-R⁷ können gleich oder verschieden sein und stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Aryl, Hydroxy, Alkoxy, Cycloalkoxy, Aryloxy, Thio, Alkylthio, Cycloalkylthio, Arylthio, Amino, ggf. substituiertes Mono- oder Dialkylamino bzw. Mono- oder Diarylamino bzw. N-Alkyl-N-arylamino, wobei Alkyl und

115

Aryl gleich oder verschieden sein können, Cycloalkyl-
amino, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Cycloalkylsulfonyl,
Arylsulfonyl, Sulfoxyl, Alkylsulfoxyl, Cycloalkylsulfo-
xyl, Arylsulfoxyl, Alkylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl,
Arylcarbonyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkoxy-
carbonyl, Aryloxycarbonyl, Aminocarbonyl, ggf. substi-
tuiertes Mono- oder Dialkylaminocarbonyl bzw. Mono-
oder Diarylaminocarbonyl bzw. N-Alkyl-N-arylamino-carbo-
nyl, wobei Alkyl und Aryl gleich oder verschieden sein
können, Alkoxycarbonylamino, Cycloalkoxycarbonylamino,
Aryloxycarbonylamino, Halogen, Haloalkyl, Haloalkoxy,
Haloalkylthio, Haloalkylamino, Haloalkylsulfonyl, Halo-
alkylsulfoxyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl,
Haloalkylamimocarbonyl, Haloalkoxycarbonylamino, Cyano
oder Nitro;

R⁴, R⁵ können gemeinsam eine fünf- oder sechsgliedrige, gesät-
tigte oder ungesättigte, aromatische oder nicht aroma-
tische, ggf. subst. Alkylen-, Alkenylen- oder Alkdieny-
lenkette bilden;

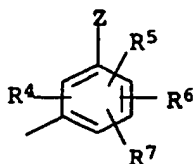
7. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach einem der
Ansprüche 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen
Formel 2a



2a

steht.

8. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 gemäß der An-
sprüche 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen For-
mel 2b

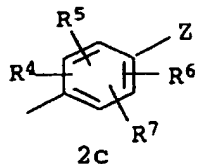


2b

steht.

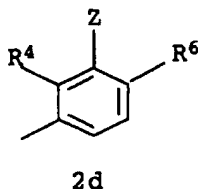
116

9. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2c



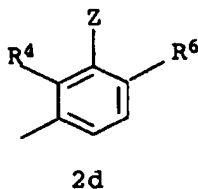
steht.

10. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach Anspruch 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2d



steht, und R⁴ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Alkyl, Alkoxy, Alkylsulfonyl, Aryloxy, Halogen oder Haloalkyl stehen.

11. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach Anspruch 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2d

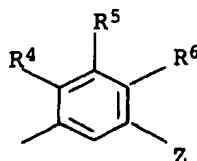


steht, und R⁴ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Tetrafluorethyl oder Trichlormethyl stehen.

117

12. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2e

5



10

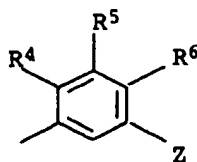
2e

steht, und R⁴, R⁵ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Alkyl, Alkoxy, Aryloxy, Alkylsulfonyl, Halogen oder Haloalkyl, stehen.

15

13. 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 gemäß nach Anspruch 12, in der R³ für einen Rest der allgemeinen Formel 2e

20



2e

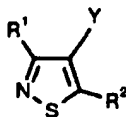
25

steht, und R⁴, R⁵ und R⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Methoxy, Ethoxy, Phenoxy, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Difluormethyl, Trifluormethyl, Tetrafluorethyl oder Trichlormethyl stehen.

30

14. Verfahren zur Herstellung der 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Isothiazolhalogenverbindung der allgemeinen Formel 3

35



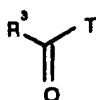
40

3

in der Y Halogen bedeutet, mit elementarem Magnesium, einer magnesiumorganischen oder einer lithiumorganischen Verbindung und einem Carbonsäurederivat der allgemeinen Formel 4,

45

118



5

4

in der T Halogen, N-Alkoxy-N-alkylamino oder Cyano bedeutet in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels in einem Temperaturbereich von -78 °C bis 111 °C miteinander umgesetzt.

10

15. Verfahren zur Herstellung der 4-Benzoylisothiazole der allgemeinen Formel 1 gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Halogenbenzol der allgemeinen Formel 5

15

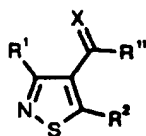


5

20

in der Y Halogen, bedeutet mit elementarem Magnesium, einer magnesiumorganischen oder einer lithiumorganischen Verbindung und einem Isothiazolcarbonsäurederivat der allgemeinen Formel 6a oder 6b,

25



6a



6b

30

in der R¹¹ Halogen oder N-Alkoxy-N-alkylamino bedeutet in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels in einem Temperaturbereich von -78°C bis 111°C miteinander umgesetzt.

35

16. Herbizide Mittel, die ein 4-Benzoylisothiazol der allgemeinen Formel 1 gemäß Anspruch 1 und inerte Zusatzstoffe enthalten.

- 40 17. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die unerwünschten Pflanzen und/oder ihren Lebensraum mit einer herbizid wirksamen Menge eines 4-Benzoylisothiazols der allgemeinen Formel 1 gemäß Anspruch 1 behandelt.

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 97/01855

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D417/10 A01N43/80

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 418 175 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 20 March 1991 see claims ---	1,2,16, 17
A	US 4 187 099 A (FRANZ JOHN E ET AL) 5 February 1980 see the whole document ---	1,2,16, 17
A	EP 0 487 357 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 27 May 1992 see claims ---	1,2,16, 17
P,A	WO 96 26192 A (BASF AG) 29 August 1996 see claims -----	1-17

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

25 June 1997

Date of mailing of the international search report

11.07.97

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Henry, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/01855

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0418175 A	20-03-91	AT 140453 T	15-08-96
		AU 635316 B	18-03-93
		AU 6231390 A	14-03-91
		BG 60562 B	28-08-95
		CA 2024956 A	12-03-91
		CN 1050188 A	27-03-91
		CN 1141294 A	29-01-97
		DE 69027823 D	22-08-96
		DE 69027823 T	09-01-97
		EG 19315 A	29-02-96
		ES 2089003 T	01-10-96
		IL 95587 A	27-11-95
		JP 3118374 A	20-05-91
		OA 9311 A	15-09-92
		RU 2060663 C	27-05-96
		TR 25897 A	01-11-93
US 4187099 A	05-02-80	NONE	
EP 0487357 A	27-05-92	AU 642785 B	28-10-93
		AU 8797791 A	28-05-92
		BG 60585 B	29-09-95
		CA 2056044 A	23-05-92
		CN 1061596 A	03-06-92
		CS 9103527 A	17-06-92
		EG 19891 A	31-03-96
		HU 208963 B	28-02-94
		IL 100046 A	19-01-96
		JP 4300875 A	23-10-92
		NZ 240625 A	26-01-94
		OA 9403 A	15-09-92
		SK 278353 B	08-01-97
		RU 2057750 C	10-04-96
		TR 25654 A	01-07-93
WO 9626192 A	29-08-96	AU 4875296 A	11-09-96

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern. Signales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01855

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 C07D417/10 A01N43/80

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 418 175 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 20.März 1991 siehe Ansprüche ---	1,2,16, 17
A	US 4 187 099 A (FRANZ JOHN E ET AL) 5.Februar 1980 siehe das ganze Dokument ---	1,2,16, 17
A	EP 0 487 357 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 27.Mai 1992 siehe Ansprüche ---	1,2,16, 17
P,A	WO 96 26192 A (BASF AG) 29.August 1996 siehe Ansprüche -----	1-17

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benützung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

25.Juni 1997

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

11.07.97

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Henry, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01855

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0418175 A	20-03-91	AT 140453 T	15-08-96
		AU 635316 B	18-03-93
		AU 6231390 A	14-03-91
		BG 60562 B	28-08-95
		CA 2024956 A	12-03-91
		CN 1050188 A	27-03-91
		CN 1141294 A	29-01-97
		DE 69027823 D	22-08-96
		DE 69027823 T	09-01-97
		EG 19315 A	29-02-96
		ES 2089003 T	01-10-96
		IL 95587 A	27-11-95
		JP 3118374 A	20-05-91
		OA 9311 A	15-09-92
		RU 2060663 C	27-05-96
		TR 25897 A	01-11-93

US 4187099 A	05-02-80	KEINE	

EP 0487357 A	27-05-92	AU 642785 B	28-10-93
		AU 8797791 A	28-05-92
		BG 60585 B	29-09-95
		CA 2056044 A	23-05-92
		CN 1061596 A	03-06-92
		CS 9103527 A	17-06-92
		EG 19891 A	31-03-96
		HU 208963 B	28-02-94
		IL 100046 A	19-01-96
		JP 4300875 A	23-10-92
		NZ 240625 A	26-01-94
		OA 9403 A	15-09-92
		SK 278353 B	08-01-97
		RU 2057750 C	10-04-96
		TR 25654 A	01-07-93

WO 9626192 A	29-08-96	AU 4875296 A	11-09-96

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

☐ **BLACK BORDERS**

☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**

☒ **FADED TEXT OR DRAWING**

☒ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**

☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**

☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**

☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**

☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**

☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**

☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.